

## (12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局(43)国際公開日  
2001年9月20日 (20.09.2001)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 01/68613 A1(51)国際特許分類: C07D 239/36, 239/47,  
403/04, 405/04, 413/04, A01N 43/54

Akira) [JP/JP]. 前田兼成 (MAEDA, Kazuhige) [JP/JP]. 秋山茂明 (AKIYAMA, Shigeaki) [JP/JP]. 八尾坂学 (YAOSAKA, Manabu) [JP/JP]. 森本勝之 (MORIMOTO, Katsushi) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba (JP). 中平国光 (NAKAHIRA, Kunimitsu) [JP/JP]. 大木 亨 (OHKI, Tooru) [JP/JP]. 濱田暢之 (HAMADA, Nobuyuki) [JP/JP]. 矢野哲彦 (YANO, Tetsuhiko) [JP/JP]. 野口順子 (NOGUCHI, Junko) [JP/JP]. 渡辺重臣 (WATANABE, Shigeomi) [JP/JP]; 〒349-0218埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

(21)国際出願番号: PCT/JP01/02158

(22)国際出願日: 2001年3月19日 (19.03.2001)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
特願2000-76493 2000年3月17日 (17.03.2000) JP  
特願2000-357541 2000年11月24日 (24.11.2000) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo (JP).

(72)発明者; および  
(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 工藤佳宏 (KUDO, Yoshihiro) [JP/JP]. 勝又 章 (KATSUMATA,

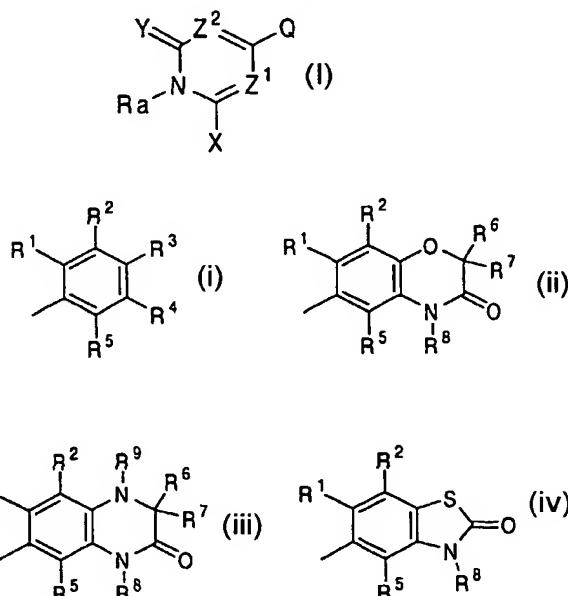
(74)代理人: 泉名謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 烏本鋼業ビル Tokyo (JP).

(81)指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT,

[統葉有]

(54)Title: PYRIMIDINONE DERIVATIVES AND HERBICIDES

(54)発明の名称: ピリミジノン誘導体及び除草剤



**(57)Abstract:** Compounds of the general formula (I) or salts thereof, and pesticides and herbicides, containing the compounds as the active ingredient wherein Ra is hydrogen, cyano, or the like; X is hydrogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, or the like; Y is O or S; Z<sup>1</sup> and Z<sup>2</sup> are each independently N or CRb, wherein Rb is hydrogen, halogeno, or the like, with the proviso that when Z<sup>1</sup> is N, Z<sup>2</sup> is CRa, while when Z<sup>1</sup> is CRa, Z<sup>2</sup> is N; and Q is a group of the general formula (i), (ii), (iii), (iv) or the like [wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are each independently hydrogen or halogeno; R<sup>3</sup> is hydrogen, halogeno, or the like; R<sup>4</sup> is hydrogen, halogeno, or the like; R<sup>5</sup> is hydrogen, halogeno, or the like; R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> are each independently hydrogen, halogeno, or the like; and R<sup>8</sup> and R<sup>9</sup> are each independently hydrogen, C<sub>1-8</sub> alkyl, or the like].

WO 01/68613 A1

[統葉有]



RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

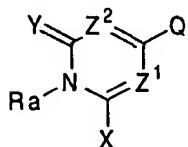
添付公開書類:  
— 国際調査報告書

(84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,  
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,  
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許  
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,  
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

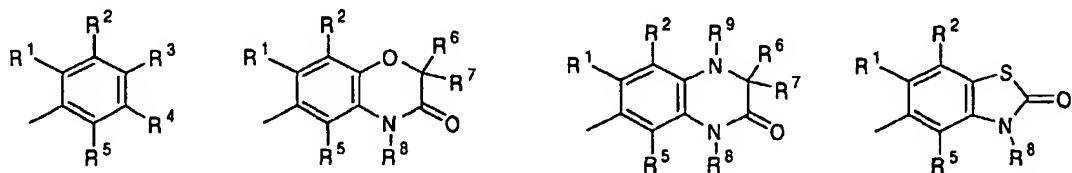
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドノート」を参照。

(57) 要約:

新規除草剤の提供。式(I):



[式中、Raは水素原子、シアノ基等を表し、Xは水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基等を表し、YはOまたはSを表し、Z<sup>1</sup>及びZ<sup>2</sup>はそれぞれ独立してNまたはCRbを表し、Rbは水素原子、ハロゲン原子等を表し、但しZ<sup>1</sup>がNを表すときはZ<sup>2</sup>はCRaを表し、Z<sup>1</sup>がCRaを表すときはZ<sup>2</sup>はNを表し、Qは



等を表し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して水素原子またはハロゲン原子を表し、

R<sup>3</sup>は水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R<sup>4</sup>は水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R<sup>5</sup>は水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R<sup>8</sup>及びR<sup>9</sup>はそれぞれ独立して水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキル基等を表す。]で示される化合物及びこれらの塩、ならびに該化合物を有効成分として含む農薬及び除草剤。

## 明細書

## ピリミジノン誘導体及び除草剤

## 技術分野

本発明は新規なピリミジノン誘導体及びそれを有効成分として含有する除草剤に関するものである。

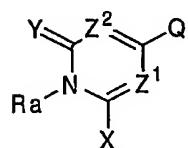
## 技術背景

ピリミジノン環の特定の位置に、置換フェニル基が結合した本願発明の化合物群が除草作用を示すことは従来全く知られていない。

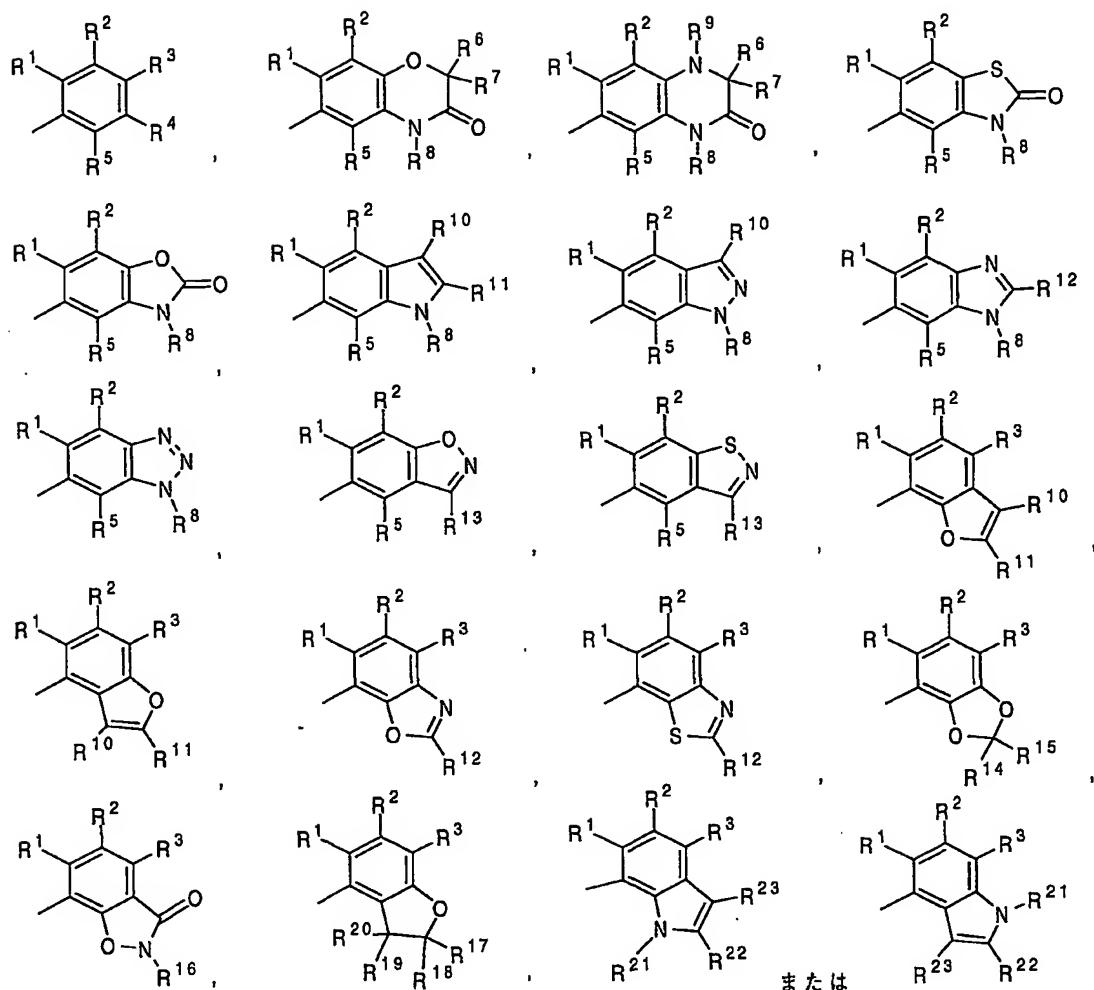
## 発明の開示

本発明者らは新規なピリミジノン誘導体の除草作用について鋭意検討した結果、下記式で示される化合物が優れた除草作用を有することを見い出し本発明を完成するに至った。すなわち、本発明は〔1〕～〔6〕に関する。

〔1〕式（1）：



〔式中、Qは式（2）：



を表し、

R<sub>a</sub>は水素原子、シアノ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、シアノC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)カルボニル基または(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニル基を表し、

Xは水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、アミノ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルアミノ基、または(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>アミノ基を表し、

Yは酸素原子または硫黄原子を表し、

$Z^1$ および $Z^2$ はそれぞれ独立して窒素原子またはCRbを表し、但し、 $Z^1$ が窒素原子を表すときは $Z^2$ はCRbを表し、 $Z^1$ がCRbを表すときは $Z^2$ は窒素原子を表し、

Rbは水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基またはシアノ基を表し、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立しては水素原子またはハロゲン原子を表し、

R<sup>3</sup>は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基、アミノ基、ホルミル基、カルボキシル基、シアノメチル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、スルファモイル基、チオカルバモイル基、カルバモイル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニル基、トリメチルシリルエチニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルアミノ基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>アミノ基、置換フェニル基、置換フェニルカルボニル基、置換フェニルカルボニルオキシ基、置換フェニルメチル基、置換フェニルスルホニル基、置換フェニル—L—O、置換フェニル—L—NH、置換フェニル—L—SまたはC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルOC(O)—L—Oを表し、

R<sup>4</sup>は水素原子、ハロゲン原子、ホルミルアミノ基、シアノ基、クロロスルホニル基、ニトロ基、ヒドラジノ基、置換フェニル基、1,3-ジオキソラン-2-イル基、1,3-ジオキサン-2-イル基、C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルキル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>ハロゲノシクロアルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキル)カルボニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>ハロアルキル)カルボニル基、R<sup>30</sup>O、R<sup>30</sup>—L—O、R<sup>30</sup>C(O)—L—O、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、2-ピリミジニルオキシ基、2-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基、5-クロロ-2-ピリジルオキシ基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジル

オキシ基、 $R^{30}S$ 、 $R^{30}NH$ 、 $R^{31}OC(O)$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)$ 、 $R^{33}SO_2NHC(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L$ 、 $R^{30}C(O)$ 、 $R^{30}-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)-L-NH$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-NH$ 、 $R^{30}C(O)-L-NH$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L-SO_2$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-S$ 、 $R^{30}C(O)-L-S$ 、 $R^{34}SO_2NH$ 、 $(R^{34}SO_2)_2N$ 、 $R^{34}SO_2(R^{35})N$ 、 $R^{36}OC(O)NH$ 、 $R^{36}OC(O)(R^{35})N$ 、 $R^{31}OC(O)-L-(R^{35})N$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-(R^{35})N$ 、置換フェニル( $R^{35})N$ 、 $R^{30}R^{35}N$ 、 $R^{36}CONH$ 、 $R^{36}C(O)(R^{35})N$ 、 $R^{37}ON=C H$ 、 $(C_1-C_4\text{アルコキシ})_2P(O)-L$ 、 $R^{30}O-L$ 、 $R^{30}S-L$ 、 $R^{30}NH-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L$ 、 $R^{30}S(O)-L$ 、 $R^{30}SO_2-L$ 、 $NC-L$ 、 $R^{30}CO_2-L$ 、 $R^{30}C(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NCO_2$ 、 $(R^{38}O)R^{31}NC(O)-L$ 、(2-クロロ-4-ブタノリド-2-イル) $C_1-C_4\text{アルキル基}$ 、 $R^{38}-O-N=C(R^{37})-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)C_1-C_4\text{アルキレン}-O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{30}C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{30}-O-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-S$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})$ 、 $R^{31}R^{32}NC(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NNR^{31}R^{32})-L$ 、 $(C_1-C_4\text{アルキル})_3Si-L-O$ 、 $(C_1-C_4\text{アルキル})_3Si-L-O-CH_2-O$ または置換されていてもよい5~6員のヘテロ環を表し、

$R^6$ は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル基、メルカプト基、 $C_1-C_4\text{アルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルケニル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルキニル基}$ 、 $C_1-C_4\text{アルコキシ基}$ 、 $C_1-C_4\text{ハロアルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルケニルオキシ基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルキニルオキシ基}$ 、2,3-エポキシ-2-メチルプロピル基または2-メチル-2-プロペニル基を表し、

$R^6$ および $R^7$ はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6\text{アルキル基}$ 、シアノ基または $C_1-C_6\text{ハロアルキル基}$ を表し、

$R^8$ および $R^9$ はそれぞれ独立して水素原子、 $C_1-C_8\text{アルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルケニル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルキニル基}$ 、 $C_1-C_8\text{ハロアルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{ハロア$

ルケニル基、 $C_2-C_8$ ハロアルキニル基、 $(C_1-C_6\text{アルキル})$ カルボニル基、 $(C_1-C_6\text{ハロアルキル})$ カルボニル基、ホルミル基、ベンゾイル基、フェナシル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6\text{アルコキシ})$ カルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $NC-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L$ 、 $R^{31}OC(O)=NOR^{38}-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)=OOR^{38}-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)=NOR^{38}-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)=OOR^{38}-L-O$ または置換フェニル-Lを表し、

$R^{10}$ は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $(C_1-C_4\text{アルコキシ})$ カルボニル基または $(C_1-C_4\text{アルキル})$ カルボニル基を表し、

$R^{11}$ は水素原子、ホルミル基、カルボキシル基、ヒドロキシメチル基、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ ハロアルキル基、 $(C_1-C_6\text{アルキル})$ カルボニル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルキルチオ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $(C_1-C_4\text{アルコキシ})$ カルボニル基、 $(C_1-C_4\text{アルキル})$ アミノカルボニル基、 $C_1-C_4$ アルキル-CH(OH)、 $C_2-C_4$ アルケニル-CH(OH)、 $C_3-C_8$ シクロアルキル-CH(OH)または $(C_3-C_8\text{シクロアルキル})$ カルボニル基を表し、

$R^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ ハロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基または $C_1-C_4$ アルコキシ $(C_1-C_4)$ アルキル基を表し、

$R^{13}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基または置換フェニル基を表し、

$R^{14}$ および $R^{15}$ はそれぞれ独立して水素原子または $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{16}$ は水素原子または $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ および $R^{20}$ はそれぞれ独立して水素原子または $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{21}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $(C_1-C_6\text{アルキル})$ カルボニル基、 $(C_1-C_6\text{ハロアルキル})$ カルボニル基、 $(C_1-C_6\text{アルコキシ})$ カルボニル基

、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>ハロアルキルスルホニル基またはC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基を表し、

R<sup>22</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルキル基、ヒドロキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基またはC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基を表し、

R<sup>23</sup>は水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキル基、ニトロ基、アミノ基、シアノ基、ホルミル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキル)カルボニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルキル)カルボニル基、カルボキシリル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニル基、ヒドロキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、R<sup>38</sup>ON=CHまたはR<sup>38</sup>ON=C(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)を表し、

R<sup>30</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、4—ブタノリド—2—イル基、5—ペンタノリド—2—イル基、6—ヘキサノリド—2—イル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)アミノカルボニル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(テトラヒドロフラン—2—イル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(2,2—ジメチル—1,3—ジオキソラン—4—イル)メチル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(テトラヒドロピラン—2—イル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(フラン—2—イル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニルオキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニルオキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、置換フェニルオキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、置換フェニルC<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、置換フェニルC<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニル基、シアノC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、ベンジルオキシメチル基、テトラヒドロピラン—2—イル基、オキシラニル基、オキシラニルメチル基、テトラヒドロフラン—2—イル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>アルキル)カルボニル基、シアノC<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルキル)カルボニル基

、置換フェニル基、(テトラヒドロフラン-3-イル)  $C_1-C_4$ アルキル基、(3-メチルオキセタン-3-イル)  $C_1-C_4$ アルキル基、(2-ピロリドン-1-イル)  $C_1-C_4$ アルキル基、( $C_2-C_8$ アルケニル)カルボニル基、( $C_1-C_4$ アルコキシ)  $C_1-C_4$ アルキル基、カルボニル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、 $C_1-C_8$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_8$ ハロアルキルスルホニル基、( $C_1-C_4$ アルキル)カルボニルオキシ  $C_1-C_4$ アルキル基、( $C_1-C_4$ ハロアルコキシ)カルボニル基、(置換されていてもよい5から6員ヘテロ環)  $C_1-C_4$ アルキル基、テトラヒドロピラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-4-イル基、(テトラヒドロピラン-3-イル)  $C_1-C_4$ アルキル基、(テトラヒドロピラン-4-イル)  $C_1-C_4$ アルキル基または1-メチルピロリジン-3-イル基を表し、

$R^{31}$ は水素原子、 $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル  $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_6$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ  $C_1-C_4$ アルキル基、オキセタン-3-イル基、 $C_1-C_4$ アルキルアミノ基、( $C_1-C_4$ アルキル)<sub>2</sub>アミノ基、 $C_1-C_4$ アルキリデンイミノ基、置換されていてもよいフェニル基、ベンジル基、( $C_2-C_8$ アルケニル)オキシカルボニル  $C_1-C_4$ アルキル基、( $C_2-C_8$ アルキニル)オキシカルボニル  $C_1-C_4$ アルキル基、( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル  $C_1-C_4$ アルキル基、(テトラヒドロフラン-2-イル)  $C_1-C_4$ アルキル基、( $C_1-C_4$ アルキル)<sub>2</sub>アミノ  $C_1-C_4$ アルキル基、置換されていてもよい5から6員ヘテロ環、 $C_2-C_6$ ハロアルケニル基または $C_1-C_4$ アルキルチオ  $C_1-C_4$ アルキル基を表し、

$R^{32}$ は水素原子、 $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基または $C_1-C_6$ ハロアルキル基を表し、但し、 $R^{31}$ と $R^{32}$ は結合している窒素原子とともに $C_1-C_4$ アルキル基で置換されていても良い3から8員のヘテロ環を表していてもよく、そのときのヘテロ環の構成要素は炭素、酸素、硫黄および窒素原子から任意に選択され、

$R^{33}$ は $C_1-C_4$ アルキル基または $C_1-C_4$ ハロアルキル基を表し、

$R^{34}$ は $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキ

ル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニル基、ベンジル基またはフェニル基を表し、

R<sup>3-5</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、シアノC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、ホルミル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)カルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル)カルボニル基または置換フェニルカルボニル基を表し、

$R^{3-6}$ は  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、置換フェニル基または置換フェニル  $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{3,7}$  は  $C_1-C_6$  アルキル基または  $(C_1-C_3$  アルコキシ) カルボニル  $C_1-C_6$  アルキル基を表し、

$R^{3,8}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基またはベンジル基を表し、

$R^{3,9}$  は  $C_1-C_8$  アルキル基、 $C_2-C_8$  アルケニル基、 $C_2-C_8$  アルキニル基、  
 $(C_1-C_6$  アルキル) カルボニル基、 $(C_1-C_6$  アルコキシ) カルボニル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基または $(C_1-C_4$  アルコキシ) $_2P(O)$  を表し、

しは飽和あるいは不飽和の分岐していてもよく、ハロゲン原子、シアノ基または( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基によって置換されていてもよい $C_1-C_6$ のアルキレン鎖を表し、

置換フェニルはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシリ  
基、ヒドロキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロ  
アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、(C  
<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)カルボニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニルC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ア  
ルキルオキシ基、OCH(CH<sub>3</sub>)CO<sub>2</sub>H、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコ  
キシ)カルボニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ア  
ルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニルC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ア  
ルケニルオキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニルC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ基、(C<sub>1</sub>

$-C_4$ アルキニルオキシ $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルコキシ基または( $C_1-C_4$ ハロアルコキシ $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよいフェニル基を表し、

置換されていてもよい5から6員ヘテロ環はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル基、ヒドロキシ基、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、( $C_1-C_4$ アルキル)カルボニル基、( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルキルオキシ基、 $OCH(C_2H_5)CO_2H$ 、 $OCH_2CO_2H$ または( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基によって任意に置換されていてもよい5から6員ヘテロ環を表し、

但し、これらの化合物に光学活性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの混合物および単離された異性体の双方を包含する。]で示されるピリミジノン誘導体およびその塩。

[2]  $R_a$ が $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基または $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基を表し、

$X$ が水素原子、 $C_1-C_4$ アルキル基またはアミノ基を表し、

$Y$ が酸素原子を表し、

$Z^1$ が窒素原子を表し、

$Z^2$ が $CR_b$ を表し、

$R_b$ がハロゲン原子を表し、

$R'$ が水素原子またはフッ素原子を表し、

$R^2$ が水素原子を表す[1]記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

[3]  $X$ がメチル基を表す[2]記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

[4]  $R_a$ が $CHF_2$ または $CF_3$ を表す[2]記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

[5] [1]～[4]記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する農薬。

[6] [1]～[4]記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する除草剤。

### 発明を実施するための最良の形態

本発明化合物及び本発明化合物の合成中間体の置換基 R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup>、R<sup>20</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>22</sup>及びR<sup>23</sup>を具体的に列記する。但し、記号はそれぞれ以下の意味を表す。

Me：メチル、Et：エチル、Pr：ノルマルプロピル、iso-Pr：イソプロピル、cyclo-Pr：シクロプロピル、Bu：ノルマルブチル、sec-Bu：セカンダリーブチル、iso-Bu：イソブチル、tert-Bu：ターシャリーブチル、cyclo-Bu：シクロブチル、Pen：ノルマルペンチル、cyclo-Pen：シクロペンチル、iso-Pen：イソペンチル基ne-o-Pen：ネオペンチル基cyclo-Hex：シクロヘキシル、tert-Pen：ターシャリーペンチル、Hex：ノルマルヘキシル、Hep：ノルマルヘプチル、Oct：ノルマルオクチル、Ph：フェニル基

#### [置換基 R<sub>a</sub> の具体例]

CF<sub>3</sub>H、CF<sub>3</sub>、Me、Et、Pr、iso-Pr、SO<sub>2</sub>Me、CN、CH<sub>2</sub>O  
Me、CH<sub>2</sub>SMe、CH<sub>2</sub>CN または CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>

#### [置換基 R<sub>b</sub> の具体例]

H、F、Cl、Br、I、CN、OMe、OCF<sub>3</sub>H または OCF<sub>3</sub>

#### [置換基 X の具体例]

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、CF<sub>3</sub>H、NH<sub>2</sub>、OMe、OEt、OPr、O(iso-Pr)、OCF<sub>3</sub>H、OCF<sub>3</sub>、SMe、SET、SPr、S(iso-Pr)、SO<sub>2</sub>Me、SO<sub>2</sub>Et、SO<sub>2</sub>Pr、SO<sub>2</sub>(iso-Pr)、NHMe、NHEt、NHP<sub>r</sub>、NH(iso-Pr)、NMe<sub>2</sub>、NET<sub>2</sub>、NPr<sub>2</sub> または N(iso-Pr)<sub>2</sub>

#### [置換基 Y の具体例]

O または S

#### [置換基 R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> の具体例]

H、F、Cl、Br または I

#### [置換基 R<sup>3</sup> の具体例]

H、F、Cl、Br、I、C≡N、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)NH<sub>2</sub>、C≡CSiMe<sub>3</sub>、C≡CH、CH=CH<sub>2</sub>、Me、Et、Pr、iso-Pr、OMe、OEt、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CF<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>、ClCF<sub>2</sub>、HCF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>O、NO<sub>2</sub>、HCF<sub>2</sub>O、ClCH<sub>2</sub>、BrCH<sub>2</sub>、SMe、SO<sub>2</sub>Me、OH、SH、NH<sub>2</sub>、CHO、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>Pr、CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、CO<sub>2</sub>Bu、CO<sub>2</sub>(tert-Bu)、CH<sub>2</sub>C≡N、NHMe、NMe<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>Ph、OCH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Me-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Br-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Cl-2-(OCHMeCO<sub>2</sub>Me)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Me-2-(OCHMeCO<sub>2</sub>E)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Me-2-(OCHMeCO<sub>2</sub>Et)-Ph)、NHCH<sub>2</sub>Ph、NHCH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph)、NHCH<sub>2</sub>(4-Me-Ph)、NHCH<sub>2</sub>(4-Br-Ph)、NHCH<sub>2</sub>(4-Cl-2-(OCHMeCO<sub>2</sub>Me)-Ph)、SCH<sub>2</sub>Ph、SCH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph)、SCH<sub>2</sub>(4-Me-Ph)、SCH<sub>2</sub>(4-Br-Ph)、SCH<sub>2</sub>(4-Me-2-(OCHMeCO<sub>2</sub>Me)-Ph)、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pr、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(tert-Bu)、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、SCO<sub>2</sub>MeまたはSCO<sub>2</sub>Et

[置換基R<sup>1</sup>の具体例]

H、F、Cl、Br、I、CHO、CO<sub>2</sub>H、C(O)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>Cl、C(O)Me、SH、OH、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、Ph、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、cyclo-Pr、cyclo-Bu、cyclo-Pen、cyclo-Hex、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH(Me)CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、CH(Me)C≡CH、OMe、OEt、O(iso-Pr)、OPr、OBu、O(sec-Bu)、O(tert-Bu)、O(iso-Bu)、O(cyclo-Pen)、O(cyclo-Pr)、O(cyclo-

o-Hex)、O(neo-Pen)、O(tert-Pen)、Open、O Hex、O Hep、OOct、OCH<sub>2</sub>Ph、OPh、O(4-Cl-Ph)、O(3-Cl-Ph)、O(2-Cl-Ph)、O(4-Me-Ph)、O(3-Me-Ph)、O(2-Me-Ph)、O(4-MeO-Ph)、O(3-MeO-Ph)、O(2-MeO-Ph)、OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH=CHMe、OCHMeCH=CH<sub>2</sub>、OCMe<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C≡CH、OCHMeC≡CH、OCMe<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>CH=CClH、OCH<sub>2</sub>CCl=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>C≡CH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OPr、OCH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>Ph、OCH<sub>2</sub>O(cyclo-Pen)、OCH<sub>2</sub>O(cyclo-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(cyclo-Pr)、OCH<sub>2</sub>O(tert-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(iso-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(sec-Bu)、OCH<sub>2</sub>OPr、OCH<sub>2</sub>O(iso-Pr)、OCH<sub>2</sub>OBu、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Sime<sub>3</sub>、OCH(Me)OMe、O-(テトラヒドロピラン-2-イル)、O-(テトラヒドロピラン-3-イル)、O-(テトラヒドロピラン-4-イル)、O-(テトラヒドロフラン-2-イル)、O-(テトラヒドロフラン-3-イル)、O-オキシラニル、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Bu)、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Hex)、OCH<sub>2</sub>(1,5-ジメチルピラゾール-1-イル)、O-(2,3-エポキシプロピル)、OCH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>(テトラヒドロフラン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)、OCH(CH<sub>2</sub>OEt)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>(テトラヒドロピラン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(フラン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(フラン-3-イル)、OCH<sub>2</sub>(テトラヒドロフラン-3-イル)、OCH<sub>2</sub>(3-メチルオキセタン-3-イル)、OCHMe(cyclo-Pr)、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH=C<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C≡CM<sub>e</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CM<sub>e</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SM<sub>e</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OC(O)Me、OCH<sub>2</sub>CH

$\text{CH}_2$  (モルホリン-1-イル)、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2$  (ピロリジン-1-イル)、 $\text{OCH}_2$   
 $\text{CH}_2$  (2-ピロリドン-1-イル)、 $\text{O}-$ (2-シクロヘキセン-1-イル)  
 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2$   
 $\text{CH}_2\text{OPh}$ 、 $\text{OCHe}\text{tC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCHPr}\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}(\text{iso-Bu})\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCHPh}\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCHBu}\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}(\text{iso-Pr})\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}(\text{CHMePr})\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CPH}$ 、 $\text{OCH}_2$   
 $\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCHMe}\text{C}\equiv\text{CEt}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}=\text{C(Me)}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCHe}\text{tCH}_2\text{OC}$   
 $\text{H}_2\text{CHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OPr}$ 、 $\text{OCHMe}$   
 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHMe}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Cl})\text{CH}_2\text{O}(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Cl})\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHCl}$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OCHCl}$   
 $\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCHBr}\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$ 、 $\text{OCHe}\text{tCH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{O}(\text{1-メチルピロリジン-3-イル})$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(2-\text{Cl-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCHe}\text{tCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{F})_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CHMeOPh}$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OCMe}_3$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{OCHe}\text{tCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeCH}=\text{CHMe}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CHClCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Br})_2$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHPh}\text{C}$   
 $\text{O}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHPh}\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}$   
 $\text{H}_2\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C(O)Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2$  (オキシラニル)、 $\text{O}-$ (  
 $\text{ピリミジン-2-イル})$ 、 $\text{O}-$ (4-ブタノリド-2-イル)、 $\text{O}-$ (2, 3-エポキシプロピル)、 $\text{OCH}_2\text{CN}$ 、 $\text{OCHMeCN}$ 、 $\text{O}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{O}(\text{C})$

O)Et、OC(O)Pr、OC(O)(iso-Pr)、OC(O)CH=CMez、OC(O)CH<sub>2</sub>Cl、OC(O)CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、OC(O)(モルホリ  
ン-1-イル)、OC(O)CH<sub>2</sub>OMe、OCO<sub>2</sub>Me、OCO<sub>2</sub>Et、OCO<sub>2</sub>  
Pr、OCO<sub>2</sub>iso-Pr、OCO<sub>2</sub>Ph、OC(O)NH<sub>2</sub>、OC(O)NM  
e<sub>2</sub>、OC(O)NEt<sub>2</sub>、OC(O)NPr<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、O(iso-Pen)、SMe、SET、S(iso-Pr)、SPr、SBu、S(sec-Bu)  
、S(iso-Bu)、S(cyclo-Pen)、S(cyclo-Pr)、S(cyclo-Hex)、S(neo-Pen)、S(tert-Pen)、SPen、SHex、SHep、SOct、SCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>  
、SCHMeCH=CH<sub>2</sub>、SCMe<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、SCH<sub>2</sub>C≡CH、SCHM  
eC≡CH、SCMe<sub>2</sub>C≡CH、SCH<sub>2</sub>CH=CClH、SCH<sub>2</sub>CCl=C  
H<sub>2</sub>、SCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、SCH<sub>2</sub>OMe  
、SCH<sub>2</sub>OEt、SCH<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、SCH<sub>2</sub>CN、NHMe、N  
He<sub>t</sub>、NH(iso-Pr)、NHP<sub>r</sub>、NHBu、NH(sec-Bu)  
、NH(iso-Bu)、NH(cyclo-Pen)、NH(cyclo-Pr)  
、NH(cyclo-Hex)、NH(neo-Pen)、NH(tert-Pen)、NHPen、NHex、NHHe<sub>p</sub>、NHOct、NHCH<sub>2</sub>CH  
=CH<sub>2</sub>、NHCHMeCH=CH<sub>2</sub>、NHCM<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、NHCH<sub>2</sub>C≡  
CH、NHCHMeC≡CH、NHCM<sub>2</sub>C≡CH、NHCH<sub>2</sub>CH=CClH  
、NHCH<sub>2</sub>CCl=CH<sub>2</sub>、NHCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、NHCH  
<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、NHCH<sub>2</sub>OMe、NHCH<sub>2</sub>OEt、NHCH<sub>2</sub>(cyclo-  
Pr)、NHCH<sub>2</sub>CN、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、CO  
<sub>2</sub>Pr、CO<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、CO<sub>2</sub>Bu、CO<sub>2</sub>(sec-Bu)、CO  
<sub>2</sub>(iso-Bu)、CO<sub>2</sub>(tert-Bu)、CO<sub>2</sub>(cyclo-Bu)、  
CO<sub>2</sub>Pen、CO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、CO<sub>2</sub>Pen、CO<sub>2</sub>(neo-P  
en)、CO<sub>2</sub>(tert-Pen)、CO<sub>2</sub>Hex、CO<sub>2</sub>(cyclo-H  
ex)、CO<sub>2</sub>He<sub>p</sub>、CO<sub>2</sub>Oct、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CHM  
eCH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CM<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、CO<sub>2</sub>CHM  
eC≡CH、CO<sub>2</sub>CM<sub>2</sub>C≡CH、CO<sub>2</sub>CM<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CM

$\text{e}_2\text{CO}_2\text{CHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{OME}$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{CONMe}_2$ 、 $\text{CONEt}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeC}_1\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeC}_1\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHBrCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{SO}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{(iso-Pr)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{(cyclo-Hex)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{(tert-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{(iso-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{(sec-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{CH}_2$ （テトラヒドロフラン-2-イル）、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeC}_1\text{C(O)NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{CH(CF}_3)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OME}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{CONHOMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(iso-Pr)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(iso-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(sec-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(tert-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(cyclo-Hex)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHCH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHNMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(Me)(Boc)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(モルホリン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHPH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(チアゾール-2-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NH(5-メチルイソオキサゾール-3-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NHCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHCl}_1\text{C(O)NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHBrC(O)NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2$

$\text{CH}_2\text{CHC(=O)NMeBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NMe(iso-Bu)}$   
 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NMeOMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NET}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NETPr}$   
 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NET(iso-Pr)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NET(tert-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(iso-Pr)}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NPr(sec-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(CH}_2\text{CH=CH}_2)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(CH}_2\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(iso-Pr)(cyclo-Hex)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(CH}_2\text{CH=CH}_2)(cyclo-Hex)$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(CH}_2\text{CH=CH}_2)(cyclo-Pen)$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NMeph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NMe(ピリジン-2-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(ピロリジン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(チオモルホリン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(4-メチルピペラジン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)N(cyclo-Hex)Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NMech}_2$   
 $\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)NOMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CMe} (= \text{NOMe})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH} (= \text{NOMe})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CHMeCH=CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2(\text{cyclo-Pr})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{CHC(=O)CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{CH=CMecl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC(=O)O}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $\text{CH}_2\text{CCl}_2\text{CN}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{(2-クロロブタノリド-2-イル)}$ 、 $\text{CH=CHCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH=CHCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{CHFCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHFCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHFCO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{OCHFCO}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CHC(=O)CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHC(=O)CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHC(=O)CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCC(=O)CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{CHBrCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHBrCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHBrCO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCHBrCO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{OCF}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCF}_2\text{CO}_2\text{E}$

t、OCF<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pr、OCF<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Bu、OCCl<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCCl<sub>2</sub>C  
O<sub>2</sub>Pen、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(tert-Bu)、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Ph、OCH<sub>2</sub>CO  
<sub>2</sub>Pen、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Hex、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、OCH<sub>2</sub>  
CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph、OCHMeCO<sub>2</sub>Me、OC  
HMeCO<sub>2</sub>Et、OCHMeCO<sub>2</sub>Pr、OCHMeCO<sub>2</sub>(iso-Pr)、  
OCHMeCO<sub>2</sub>Pen、OCHMeCO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、O-(4-  
ブタノリド-2-イル)、O-(5-ペンタノリド-2-イル)、O-(6-ヘ  
キサノリド-2-イル)、OCH(CO<sub>2</sub>Me)<sub>2</sub>、OCH(CO<sub>2</sub>Et)<sub>2</sub>、OC  
H(CO<sub>2</sub>Pr)<sub>2</sub>、OCH(CN)CO<sub>2</sub>Me、OCH(CN)CO<sub>2</sub>Et、OC  
Me<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCMe<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、OCMe<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OC  
Me<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、OCHMeCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCO  
<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>C(O)NMe<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C(O)NEt<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>  
C(O)(モルホリン-1-イル)、OCH<sub>2</sub>C(O)NMe(CH<sub>2</sub>C≡CH)  
、OCH<sub>2</sub>C(O)NMe(CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>)、OCH<sub>2</sub>C(O)NHMe、O  
CH<sub>2</sub>C(O)(ピロリジン-1-イル)、OCH<sub>2</sub>C(O)(ピペリジン-1-  
イル)、OCH<sub>2</sub>C(O)Me、OCH<sub>2</sub>C(O)Et、OCH<sub>2</sub>C(O)Pr、  
OCH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>C(O)(4-Cl-Ph)、OCH<sub>2</sub>C  
(O)(4-Br-Ph)、OCH<sub>2</sub>C(O)(3-Cl-Ph)、OCH<sub>2</sub>C(O)  
(3-Br-Ph)、OCH<sub>2</sub>C(O)(2-Cl-Ph)、OCH<sub>2</sub>C(O)  
(2-Br-Ph)、OCH<sub>2</sub>C(O)Ph、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)Ph、O  
CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph)、OCH<sub>2</sub>(3-Cl-Ph)、OCH<sub>2</sub>(2-Cl-  
Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-CF<sub>3</sub>-Ph)、OCH<sub>2</sub>(3-CF<sub>3</sub>-Ph)、OCH<sub>2</sub>  
(2-CF<sub>3</sub>-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-F-Ph)、OCH<sub>2</sub>(3-F-Ph)、  
OCH<sub>2</sub>(2-F-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Me-Ph)、OCH<sub>2</sub>(3-Me-  
Ph)、OCH<sub>2</sub>(2-Me-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph)、OCH<sub>2</sub>  
(3-MeO-Ph)、OCH<sub>2</sub>(2-MeO-Ph)、OSO<sub>2</sub>Me、OSO<sub>2</sub>  
CF<sub>3</sub>、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pr、SCH<sub>2</sub>CO  
<sub>2</sub>Bu、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pen、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Hex、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(cyclo  
-Pen)、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、SCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph、SCH

MeCO<sub>2</sub>Me、SCHMeCO<sub>2</sub>Et、SCHMeCO<sub>2</sub>Pr、SCHMeCO<sub>2</sub>(iso-Pr)、SCHMeCO<sub>2</sub>Pen、SCHMeCO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、SOCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、SOCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pr、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Bu、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pen、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Hex、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph、NHCHMeCO<sub>2</sub>Me、NHCHMeCO<sub>2</sub>Et、NHCHMeCO<sub>2</sub>Pr、NHCHMeCO<sub>2</sub>(iso-Pr)、NHCHMeCO<sub>2</sub>Pen、NHCHMeCO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、NHCO<sub>2</sub>Me、NHCO<sub>2</sub>Et、NHCO<sub>2</sub>Pr、NHCO<sub>2</sub>(iso-Pr)、NHCO<sub>2</sub>Bu、NHCO<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、NHCO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、NHCO<sub>2</sub>(iso-Bu)、NHCO<sub>2</sub>(tert-Bu)、NHCO<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>3</sub>、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、NHCO<sub>2</sub>Ph、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(2-Me-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(3-Me-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-Me-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-Et-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(2-MeO-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(3-MeO-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-F-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-CF<sub>3</sub>-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(2-F-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(3-F-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(3-Cl-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(2-Cl-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(4-CF<sub>3</sub>O-Ph)、NHSO<sub>2</sub>Me、NHSO<sub>2</sub>Et、NHSO<sub>2</sub>Pr、NHSO<sub>2</sub>(iso-Pr)、NHSO<sub>2</sub>Bu、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>Ph、N(SO<sub>2</sub>Et)CO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>OMe)SO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>C=CH<sub>2</sub>)SO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>C≡CH)SO<sub>2</sub>Et、NMeSO<sub>2</sub>Me、N(SO<sub>2</sub>Me)<sub>2</sub>、N(SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl)<sub>2</sub>、N(SO<sub>2</sub>Et)<sub>2</sub>、N(SO<sub>2</sub>Pr)<sub>2</sub>、NETSO<sub>2</sub>Et、NMeSO<sub>2</sub>Et、NETSO<sub>2</sub>Et、N(Pr)SO<sub>2</sub>Et、N(C(O)Me)SO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>OMe)SO<sub>2</sub>Me、N(CH<sub>2</sub>O

E t ) S O<sub>2</sub>M e、N (C H<sub>2</sub>C H=C H<sub>2</sub>) S O<sub>2</sub>M e、N (C H<sub>2</sub>C ≡C H) S O<sub>2</sub>M e、C O N H S O<sub>2</sub>M e、C O N H S O<sub>2</sub>E t、C O N H S O<sub>2</sub>C F<sub>3</sub>、1, 3-ジオキソラン-2-イル、1, 3-ジオキサン-2-イル、4-(E t O C (O) C H<sub>2</sub>C H<sub>2</sub>O)-P h O、4-(M e O C (O) C H<sub>2</sub>C H<sub>2</sub>O)-P h O、N M e C O<sub>2</sub>M e、N (C H<sub>2</sub>C ≡C H) C O<sub>2</sub>M e、N M e C (O) M e、N H C H O、N H C (O) C F<sub>3</sub>、N H C (O) E t、N H C (O) M e、N H C O P r、N (C H<sub>2</sub>C ≡C H) C O M e、N (C H<sub>2</sub>C H=C H<sub>2</sub>) C O<sub>2</sub>M e、N M e C O<sub>2</sub>C H<sub>2</sub>(4-M e-P h)、N (C H<sub>2</sub>C ≡C H) C O<sub>2</sub>E t、N (C H<sub>2</sub>C N) C O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (t e r t-B u)) S O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (t e r t-B u)) S O<sub>2</sub>E t、N (C (O) (2-M e O-P h)) S O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (3-M e O-P h)) S O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (4-M e O-P h)) S O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (2-M e O-P h)) S O<sub>2</sub>E t、N (C (O) (3-M e O-P h)) S O<sub>2</sub>E t、N (C (O) (4-M e O-P h)) S O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (4-M e-P h)) S O<sub>2</sub>E t、N (C (O) (4-C l-P h)) S O<sub>2</sub>M e、N (C (O) (4-C l-P h)) S O<sub>2</sub>E t、C O<sub>2</sub>(オキセタン-3-イル)、N (C H O) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>M e、N (C H O) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>E t、N (C H O) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>P e n、N (C H O) C H M e C O<sub>2</sub>M e、N (C H O) C H M e C O<sub>2</sub>E t、N (C (O) M e) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>M e、N (C (O) M e) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>E t、N (C (O) M e) C H M e C O<sub>2</sub>M e、N (C (O) M e) C H M e C O<sub>2</sub>E t、N (C H<sub>2</sub>C N) S O<sub>2</sub>M e、N (S O<sub>2</sub>M e) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>M e、N (S O<sub>2</sub>M e) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>E t、N (S O<sub>2</sub>E t) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>M e、N (S O<sub>2</sub>E t) C H<sub>2</sub>C O<sub>2</sub>E t、C F<sub>3</sub>、C F<sub>2</sub>H、C H<sub>2</sub>C l、C H<sub>2</sub>B r、C H B r<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>O H、C H B r E t、C H<sub>2</sub>C H C l C H<sub>2</sub>C l、C H (O H) C H=C H<sub>2</sub>、C H (O H) C ≡C H、C H<sub>2</sub>C H C l O C (O) M e、C H (C O<sub>2</sub>M e)<sub>2</sub>、C H (C O<sub>2</sub>E t)<sub>2</sub>、C H (C N) C O<sub>2</sub>M e、C H (C N) C O<sub>2</sub>E t、C H<sub>2</sub>C N、C H<sub>2</sub>C H<sub>2</sub>C N、C H=C H C N、C M e<sub>2</sub>C N、C H<sub>2</sub>N M e<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>N E t<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>N P r<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>S M e、C H<sub>2</sub>S E t、C H<sub>2</sub>S P r、C H<sub>2</sub>S C H<sub>2</sub>C ≡C H、C H<sub>2</sub>S C H<sub>2</sub>C H=C H<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>

SO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>OPr、CH<sub>2</sub>O(iso-Pr)、CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>C≡CH、C(OEt)、C(OR)Pr、C(O)(iso-Pr)、CH=N(OMe)、CH=N(OEt)、CH=N(OPr)、CH=N(OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et)、C(O)NHMe、C(O)NHe<sub>t</sub>、C(O)NHPr、CH=CC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH=CC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>P(O)(OMe)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>P(O)(OEt)<sub>2</sub>、NHC(O)CF<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>SMe、OCF<sub>3</sub>、OCF<sub>2</sub>H、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH(CN)CH<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、OPh、O-(ピリジン-2-イル)、O-(ピリジン-4-イル)、O-(5-CF<sub>3</sub>-3-Cl-ピリジン-2-イル)、O-(5-CF<sub>3</sub>-ピリジン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(4-Me-2-(MeOC(O)CHMeO)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-Cl-2-(MeOC(O)CHMeO)-Ph)、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、2-ピリミジニルオキシ、2-ピリジルオキシ、4-ピリジルオキシ、5-クロロ-2-ピリジルオキシ、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、3-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、OCH<sub>2</sub>(4-(MeOCH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(MeOCH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(EtOCH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(EtOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(EtOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(CH<sub>2</sub>=CHCH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(EtOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(MeOCH<sub>2</sub>CHMeO)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(FC<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(HC≡CCH<sub>2</sub>O)-Ph)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(=NOMe)OMe、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(=NOMe)OEt、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(=NOMe)OC(Me)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(=NOMe)OC(O)Et、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(=NOMe)OC(NMe<sub>2</sub>)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(=NOMe)OC(O)Et

$\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C} (= \text{NOMe})\text{OP(O)(OEt)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}_1\text{C} (= \text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C} (= \text{NNMe}_2)\text{O(iso-Pr)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C} (= \text{NNMe}_2)\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C} (= \text{NNMe}_2)\text{OC(O)Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C} (= \text{NSO}_2\text{Me})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C} (= \text{NOMe})\text{NM}_2$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{C} (= \text{NO}\text{Me})\text{O(iso-Pr)}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OC(O)Me}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OC(O)Et}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OC(O)}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OSO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{OP(O)(OEt)}$ 、 $\text{C} (= \text{NOCH}_2=\text{CHCH}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{C} (= \text{NOCH}_2\text{CH}_2\text{SiMe}_3)\text{OMe}$ 、 $\text{C} (= \text{NO(テトラヒドロピラン-2-イル)})\text{OMe}$ 、 $\text{C} (= \text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{C} (= \text{NSO}_2\text{Me})\text{OMe}$ 、 $\text{C} (= \text{NOMe})\text{NM}_2$ 、2-ピリジル、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル、フラン-2-イル、チオフェン-2-イル、5-クロロチオフェン-2-イル、4-メチル-1,3-オキサゾール-2-イル、 $\text{CH}(\text{CH}_2\text{C}_1)\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH} = \text{CH}_2$ または $\text{CH}_2\text{CHClC}_1\text{C(O)NM}_2$ (iso-Pr)

[置換基R<sup>5</sup>の具体例]

H、F、Cl、Br、I、OH、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>H、SH、Me、Et、Pr、iso-Pr、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CF<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、CH<sub>2</sub>C<sub>1</sub>、OMe、OEt、OPr、O(iso-Pr)、CH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CHMeCH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、CHMeC≡CH、OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>C≡CMe、OCH<sub>2</sub>C≡CEt、OCHMeC≡CH、OCHEtC≡CH、OCHPrC≡CH、OCHMeC≡CMe、OCHEtC≡CMe、OCHPrC≡CC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、OCHMeC≡CEt、OCHEtC≡CEt、OCHPrC≡CEt、2,3-エポキシ-2-メチルプロピル基または2-メチル-2-プロペニル基

[置換基R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>の具体例]

H、F、Me、Et、CNまたはCF<sub>3</sub>

[置換基R<sup>8</sup>およびR<sup>9</sup>の具体例]

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、C  
 $\text{H}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$   
 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{CO}_2$ (tert-Bu)、 $\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{SO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{OME}$ 、 $\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CCl}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CBr}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CHMeC}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OMe}$ 、 $\text{OEt}$ 、 $\text{OPr}$ 、 $\text{CH}(\text{Me})\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2$ (iso-Pr)、 $\text{CH}_2\text{CONH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CONHMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CONMe}_2$ 、 $\text{CHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CHMeCO}_2$ (iso-Pr)、 $\text{CHMeCONH}_2$ 、 $\text{CHMeCONHMe}$ 、 $\text{CHMeCONMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{CHMeC}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CHMeC}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{M}$ e、 $\text{CHMeC}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2$ (iso-Pr)、 $\text{OCH}_2\text{CONH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CONHMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CONMe}_2$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2$ (iso-Pr)、 $\text{OCHMeCONH}_2$ 、 $\text{OCHMeCONHMe}$ 、 $\text{OCHMeCONMe}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHMeC}(=\text{NO}$ Me) $\text{OMe}$ 、 $\text{OCHMeC}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHMeC}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}_2\text{OCH}_3$ 、 $\text{OCHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeC}\equiv\text{CH}$ または $\text{OCHMeC}\equiv\text{N}$

### [置換基 R<sup>10</sup> の具体例]

H、Cl、Br、F、I、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>Pr、CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、C(O)Me、C(O)Et、C(O)Pr、C(O)(iso-Pr)、C(O)Bu、C(O)(sec-Bu)、C(O)(iso-Bu)、C(O)(tert-Bu) または C(O)(cyclo-Pr)

〔置換基R<sup>11</sup>の具体例〕

H、CHO、CO<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>OH、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CF<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>Cl、CHMeBr、CH<sub>2</sub>Br、CHBr<sub>2</sub>、CBr<sub>3</sub>、CHMeCl、C(O)Me、C(O)Et、C(O)Pr、C(O)(iso-Pr)、C(O)Bu、C(O)(sec-Bu)、C(O)(tert-Bu)、C(O)(cyclo-Pr)、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、CHMeOEt、CHMeOMe、CH<sub>2</sub>SMe、CH<sub>2</sub>SEt、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SMe、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SET、CHMeSET、CHMeSMe、CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CSO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>Pr、CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、C(O)NHMe、C(O)NHe<sub>t</sub>、C(O)NHP<sub>r</sub>、CH(OH)Me、CH(OH)Et、CH(OH)Pr、CH(OH)CH=CH<sub>2</sub>、CH(OH)C≡CHまたはCH(OH)(cyclo-Pr)

〔置換基R<sup>12</sup>の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、NH<sub>2</sub>、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、OMe、OEt、OPr、O(iso-Pr)、OBu、O(sec-Bu)、O(iso-Bu)、O(neo-Pen)、O(tert-Pen)、OPen、OHex、SMe、SET、SPr、S(iso-Pr)、SBu、S(sec-Bu)、S(iso-Bu)、S(neo-Pen)、S(tert-Pen)、SPen、SHex、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、CHMeOEtまたはCHMeOMe

〔置換基R<sup>13</sup>の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-Me-Ph、3-Me-Ph、4-Me-Ph、2-MeO-Ph、3-MeO-Ph、4-MeO-Ph

〔置換基R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、NH<sub>2</sub>、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Penまたはtert-Pen

〔置換基R<sup>16</sup>の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Penまたはtert-Pen

〔置換基R<sup>17</sup>、R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup>およびR<sup>20</sup>の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Penまたはtert-Pen

〔置換基R<sup>21</sup>の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、C(O)CF<sub>3</sub>、C(O)Me、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、SO<sub>2</sub>Me、SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>またはCH<sub>2</sub>OMe

〔置換基R<sup>22</sup>の具体例〕

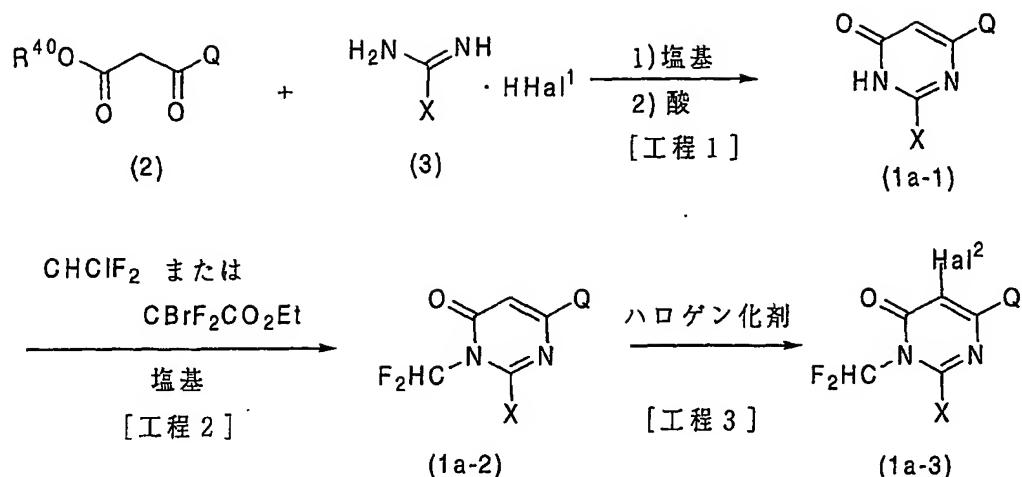
H、Me、Et、Pr、iso-Pr、cyclo-Pr、CH<sub>2</sub>Br、CH<sub>2</sub>O MeまたはCH<sub>2</sub>OH

〔置換基R<sup>23</sup>の具体例〕

H、Me、Et、Pr、CHO、C(O)Me、C(O)Et、C(O)Pr、C(O)CH<sub>2</sub>Cl、C(O)CH<sub>2</sub>Br、C(O)CF<sub>3</sub>、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CN、CH=NOH、CH=NOMe、C(Me)=NOMe、Cl、Br、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OH、SMeまたはSO<sub>2</sub>Me

本発明化合物は反応式1ないし反応式8に示す方法により製造できる。

## 〔反応式1〕



[式中、Q-及びXは前記と同様の意味を表し、Hal<sup>1</sup>及びHal<sup>2</sup>は各々独立してハロゲン原子を表し、R<sup>40</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基を表す。]

反応式1の工程1はベンゾイル酢酸類(2)とアミジン類またはその塩(3)を塩基存在下、反応させた後、酸処理することにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-1)を製造する工程である。

(3)は(2)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

塩基としては、水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及びテトラメチルグアニジン等があげられる。塩基は(2)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びトルエン等があげられる。

反応温度は通常-90~200°C、好ましくは0~120°Cである。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5~10時間で

ある。

反応終了後、溶媒を留去し、残渣に水を加え、酸処理後、固体をろ取することにより目的物を単離できる。酸処理に使用される酸としては塩酸、硫酸、磷酸及び酢酸があげられる。

工程2はピリミジノン誘導体(1a-1)を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-2)を製造する工程である。

クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルは(1a-1)に対して通常1～100倍モル、好ましくは1～10倍モル使用する。

塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムストキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム等があげられる。塩基は(1a-1)に対して通常1～100倍モル、好ましくは1～10倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジオキサン及び1,2-ジメトキシエタン等があげられる。

反応温度は通常-90～200℃、好ましくは0～120℃である。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5～10時間である。

工程3はピリミジノン誘導体(1a-2)をハロゲン化剤と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-3)を製造する工程である。

本反応に使用されるハロゲン化剤としては、塩素、臭素、フッ素、ヨウ素、塩化スルフリル、tert-ブチルハイポクロライト、N-クロロコハク酸イミド、N-プロモコハク酸イミド及びN-ヨードコハク酸イミド等があげられる。ハロゲン化剤は(1a-2)に対して通常1～100倍モル、好ましくは1～10倍モル使用する。

本反応は必要に応じて触媒を加えることができる。使用される触媒としては塩

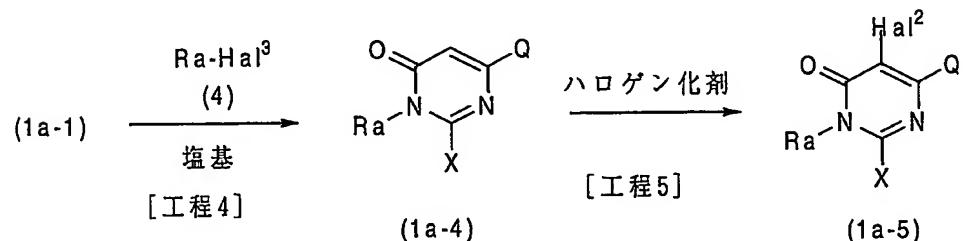
化第一銅、塩化第二銅、臭化第一銅、臭化第二銅、ヨウ化第一銅及びフッ化第二銅等があげられる。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、メタノール、エタノール及びアセトニトリル等があげられる。

反応温度は通常-90~200°C、好ましくは0~120°Cである。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5~10時間である。

[反応式2]



[式中、Q-、X、Ra及びHal<sup>2</sup>は前記と同様の意味を表し、Hal<sup>3</sup>はハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルスルホニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルオキシ基または置換フェニルスルホニルオキシ基を表す。]

反応式2の工程4はピリミジノン誘導体(1a-1)を塩基存在下、求電子試薬(4)と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-4)を製造する工程である。

(4)は(1a-1)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム等があげられる。塩基は(1a-1)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N,N-ジメチルホルムア

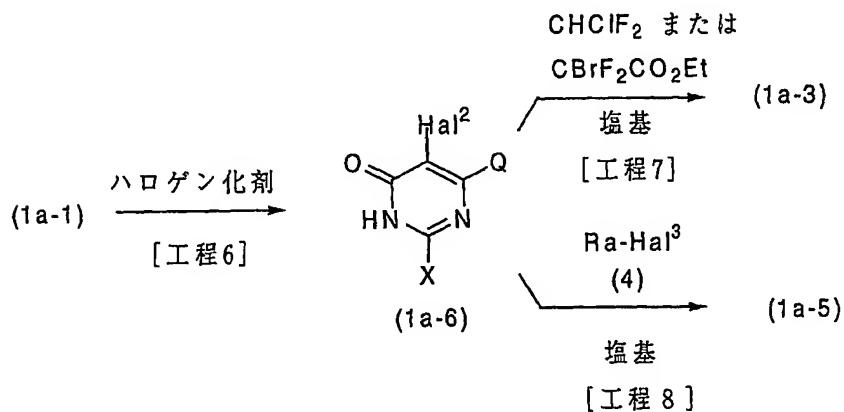
ミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジオキサン及び1、2-ジメトキシエタン等があげられる。

反応温度は通常-90~200℃、好ましくは0~120℃である。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5~10時間である。

工程5はピリミジノン誘導体(1a-4)をハロゲン化剤と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-5)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程3と同様にして実施できる。

[反応式3]



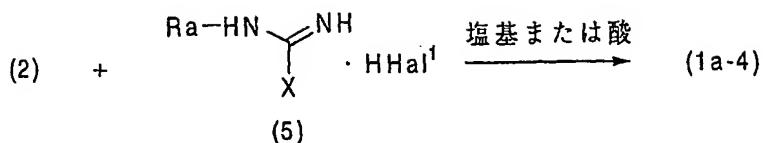
[式中、Q-、X、Ra、Hal<sup>2</sup>及びHal<sup>3</sup>は前記と同様の意味を表す。]

反応式3の工程6はピリミジノン誘導体(1a-1)をハロゲン化剤と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-6)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程3と同様にして実施できる。

工程7はピリミジノン誘導体(1a-6)を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-3)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程2と同様にして実施できる。

工程8はピリミジノン誘導体(1a-6)を塩基存在下、求電子試薬(4)と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-5)を製造する工程である。本反応は反応式2の工程4と同様にして実施できる。

## 〔反応式 4〕



〔式中、X、Ra及びHal<sup>1</sup>は前記と同様の意味を表す。〕

反応式4はベンゾイル酢酸類(2)とアミジン類またはその塩(5)を塩基または酸存在下、反応させることにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-4)を製造する方法を示す。

(5)は(2)に対して通常1～100倍モル、好ましくは1～10倍モル使用する。

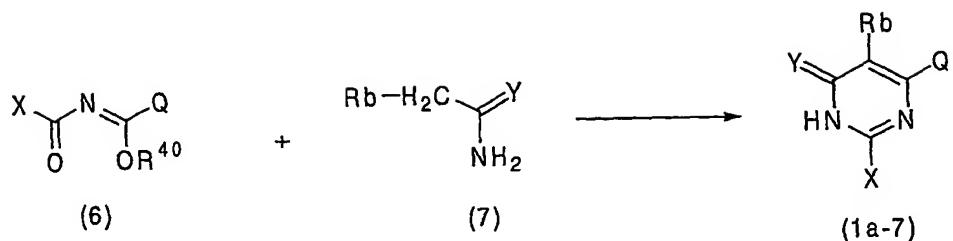
本反応に使用される塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及びテトラメチルグアニジン等があげられ、酸としては、p-トルエンスルホン酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、塩酸、硫酸、磷酸、メタンスルホン酸及びトリフルオロメタンスルホン酸等があげられる。塩基または酸は(2)に対して通常1～100倍モル、好ましくは1～10倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンゼン、トルエン、キシレン、アセトニトリル及びクロロホルム等があげられる。

反応温度は通常-90～200℃、好ましくは0～120℃である。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5～10時間である。

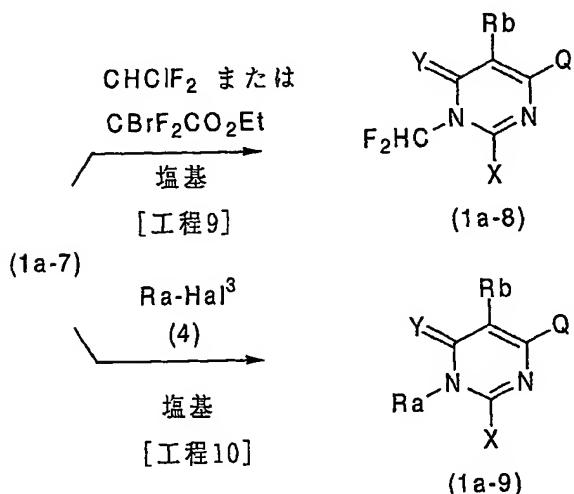
## 〔反応式5〕



[式中、 $Q^-$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $R_b$  及び  $R^{+0}$  は前記と同様の意味を表す。]

反応式5はアシルイミデート類(6)とアセトアミド類(7)を反応させることにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-7)を製造する方法を示す。本反応は、J. Chem. Soc., Perkin Trans 1, 2447(1984)に記載されている方法に準じて実施できる。

[反應式 6]



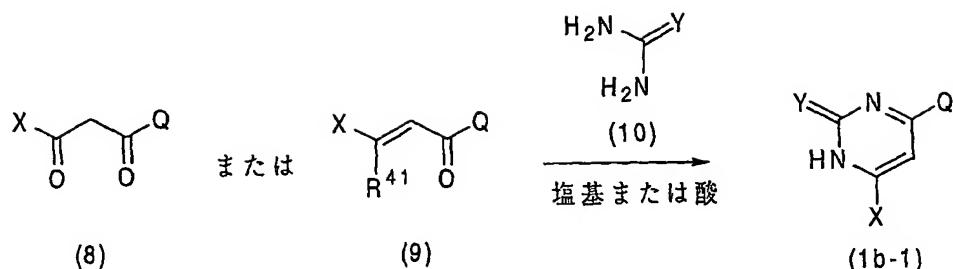
[式中、 $Q =$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 及び $H_a$ は前記と同様の意味を表す。]

反応式 6 の工程 9 はピリミジノン誘導体（1a-7）を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体（1a-8）を製造する工程である。本反応は反応式 1 の工程 2 と同様にして実施できる。

工程 10 はピリミジノン誘導体 (1a-7) を塩基存在下、求電子試薬 (4) と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1a-9) を製造する工程である。本反応は反応式 2 の工程 4 と同様にして実施できる。

8

[反應式 7]



[式中、Q-、X及びYは前記と同様の意味を表し、R<sup>4</sup>はN、N-ジメチルアミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオ基を表す。]

反応式7は $\beta$ -ジケトン類(8)またはビニルケトン類(9)と尿素類(10)を塩基または酸存在下、反応させることにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1b-1)を製造する方法を示す。

(10) は (8) または (9) に対して通常 1 ~ 100 倍モル、好ましくは 1 ~ 10 倍モル使用する。

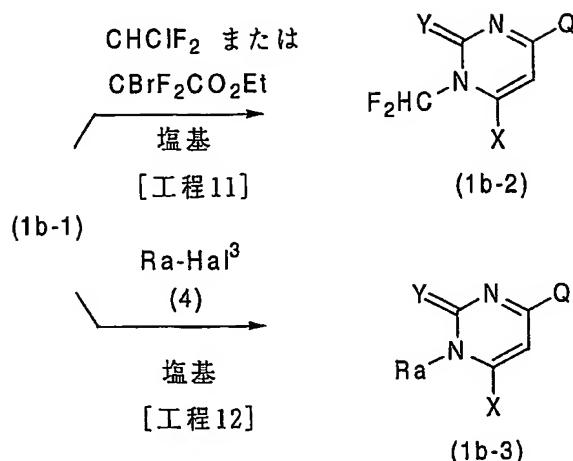
本反応に使用される塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及びテトラメチルグアニジン等があげられ、酸としては、p-トルエンスルホン酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、塩酸、硫酸、磷酸、メタンスルホン酸及びトリフルオロメタンスルホン酸等があげられる。塩基または酸は(8)または(9)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンゼン、トルエン、キシレン、アセトニトリル及びクロロホルム等があげられる。

反応温度は通常-90~200℃、好ましくは0~120℃である。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5~10時間である。

[反応式8]



[式中、Q-、X、Y、Ra及びHa<sup>13</sup>は前記と同様の意味を表す。]

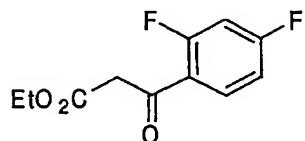
反応式8の工程11はピリミジノン誘導体(1b-1)を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1b-2)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程2と同様にして実施できる。

工程12はピリミジノン誘導体(1b-1)を塩基存在下、求電子試薬(4)と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1b-3)を製造する工程である。本反応は反応式2の工程4と同様にして実施できる。

以下に本発明化合物の合成例を実施例及び参考例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

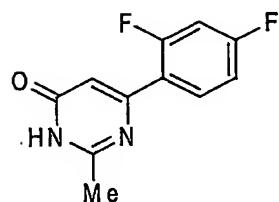
[実施例1]

(1) 2,4-ジフルオロベンゾイル酢酸エチルの合成



マロン酸エチルカリウム（56.5 g）のアセトニトリル（500 ml）懸濁液に、10℃に冷却しながらトリエチルアミン（32 g）と塩化マグネシウム（38.0 g）を加え、室温で5時間攪拌した。氷冷下、2,4-ジフルオロベンゾイルクロライド（28.6 g）をゆっくり滴下した。室温で一晩攪拌後、溶媒留去し、トルエン（200 ml）を加え、氷冷下、6規定塩酸（200 ml）を加えた。有機層を3規定塩酸及び水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒留去し、目的物21.5 gを得た。油状物質。

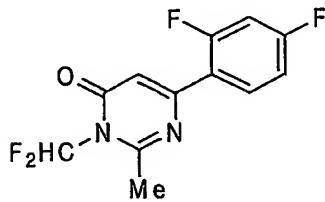
(2) 4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン  
(本発明化合物No. 10) の合成



エタノール（250 ml）にアセトアミジン塩酸塩（21.5 g）とナトリウムメトキシド（10.2 g）を加え、15分間加熱還流した。氷冷下、2,4-ジフルオロベンゾイル酢酸エチル（21.5 g）を滴下し、2時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去後、残渣に氷水（200 ml）を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物13.3 gを得た。融点250℃以上。

[実施例2]

1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン（本発明化合物No. 11）の合成



4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン（10.0 g）のN,N-ジメチルホルムアミド（100 ml）溶液に、プロモジフ

ルオロ酢酸エチル (28.0 g)、1, 2-ジメトキシエタン (100 ml) と水素化リチウム (0.90 g) を加え、0.5 時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；ヘキサン／酢酸エチル = 9 / 1) で精製し、目的物 2.60 g を得た。融点 91 - 92 °C。

また、副生成物として、6-ジフルオロメトキシ-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン 2.5 g を得た。融点 60 - 61 °C。

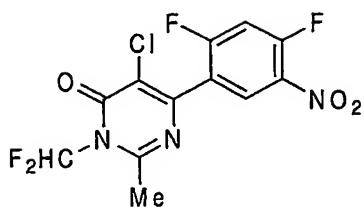
### 〔実施例 3〕

(1) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



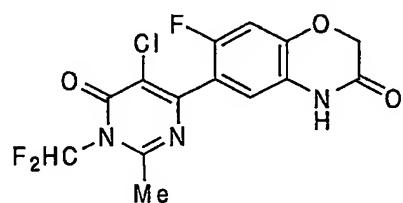
1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.5 g) のメタノール (25 ml) とクロロホルム (25 ml) 混合溶液に、塩化第二銅 (0.20 g) を加え、10 °C に冷却しながら、tert-ブチルハイポクロライト (2.0 g) をゆっくり滴下した。室温で 1 時間攪拌後、6 % 亜硫酸水素ナトリウム水溶液 (50 ml) を加え、0.5 時間激しく攪拌した。クロロホルムで抽出し、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；ヘキサン／酢酸エチル = 9 / 1) で精製し、目的物 2.2 g を得た。油状物質。

(2) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.0 g) の濃硫酸 (20 ml) 溶液に、氷冷下、硝酸 (60%、d = 1.38、1.0 g) をゆっくり滴下し、1時間攪拌した。反応液を氷水 (200 ml) に注ぎ、析出した固体をろ取、水洗、乾燥し、目的物 2.1 g を得た。油状物質。

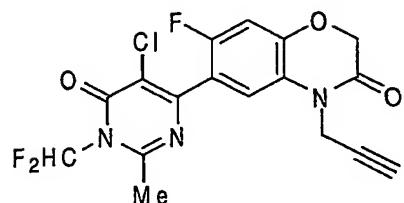
(3) 5-クロロ-4-(7-フルオロ-3-オキソ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.0 g) とグリコール酸エチル (1.2 g) のテトラヒドロフラン (50 ml) 溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム (0.35 g) を加えた。室温で3時間攪拌後、水 (300 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣に鉄粉 (2.0 g)、酢酸 (10 ml)、酢酸エチル (10 ml) と水 (30 ml) を加え、3時間加熱還流した。水 (50 ml) と酢酸エチル (100 ml) を加え、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、水及び炭酸水素ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をイソプロピルエーテルで再結晶し、目的物 1.1 g を得た。無色固体。

(4) 5-クロロ-4-(7-フルオロ-3-オキソ-4-プロパルギル-2H

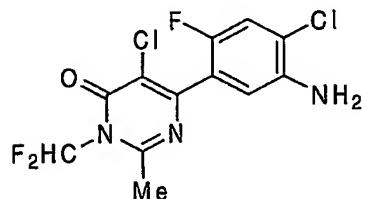
-1, 4-ベンゾオキサジン-6-イル) -1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 61) の合成



5-クロロ-4-(7-フルオロ-3-オキソ-2H-1, 4-ベンゾオキサジン-6-イル) -1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (1. 0 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、プロパルギルブロミド (1. 0 g) と炭酸カリウム (0. 6 g) を加え、3時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に水 100 ml を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン = 3/7) で精製し、目的物 0. 45 gを得た。融点 197 - 199 °C

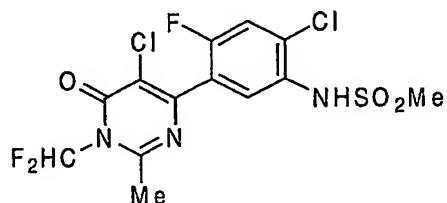
#### [実施例 4]

(1) 4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ニトロフェニル) -1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (3. 0 g) の酢酸エチル (10 ml) 溶液に、鉄粉 (2. 5 g)、酢酸 (10 ml) と水 (30 ml) を加え、3時間加熱還流した。水 (50 ml) と酢酸エチル (100 ml) を加え、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、水及び炭酸水素ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた固体をイソプロピルエーテルで再結晶し、目的物 2. 4 gを得た。樹脂状物質。

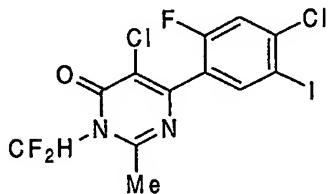
(2) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メタンスルホニルアミノフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 4)の合成



4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(0.70g)の塩化メチレン(3ml)溶液に、氷冷下、メタンスルホニルクロライド0.28gとピリジン0.33gを加えた。室温で3日間攪拌後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を1規定塩酸、水及び炭酸水素ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒留去して得られた残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン=1/1)で精製し、目的物0.35gを得た。融点170-172℃。

[実施例5]

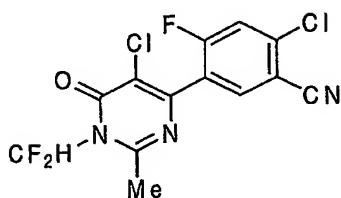
(1) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヨードフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 29)の合成



4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(2.0g)のアセトン(10ml)溶液に12規定塩酸(2ml)、水(15ml)及びヨウ化カリウム(2.0g)を加え、氷冷下、亜硝酸ナトリウム(0.80g)の水(2ml)溶液を滴下した。室温で0.5時間攪拌後、反応混合物を氷水(200ml)及

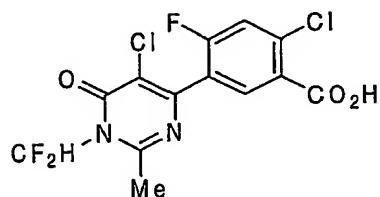
ビジエチルエーテル（100ml）の混合液中に注いだ。激しく攪拌しながら亜硫酸水素ナトリウムをヨウ素の色が消えるまで加えた。エーテル層を分離し、水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液；酢酸エチル／ヘキサン=1/9）で精製し、目的物1.9gを得た。融点101-102°C。

(2) 5-クロロ-4-(4-クロロ-5-シアノ-2-フルオロフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン（本発明化合物No.30）の合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヨードフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン（1.6g）のN,N-ジメチルホルムアミド（20ml）溶液にシアノ化銅（I）（0.42g）を加え、窒素雰囲気下で5時間加熱還流した。氷冷下、塩化鉄（III）（0.50g）の濃塩酸（2ml）溶液を加え、0.25時間激しく攪拌した。反応混合物を水（100ml）と酢酸エチル（100ml）の混合溶媒中に注ぎ、不溶物をろ別した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板（展開溶媒；酢酸エチル／ヘキサン=3/7）で精製し、目的物1.0gを得た。融点124-125°C。

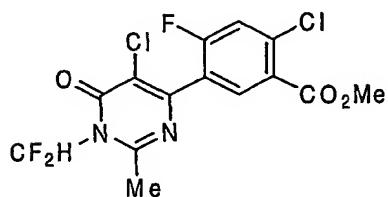
(3) 2-クロロ-5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン-4-イル)-4-フルオロ安息香酸の合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-5-シアノ-2-フルオロフェニル)-1-

ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (1.0 g) を49%硫酸 (10 ml) に加え、0.5時間加熱還流した。反応混合物を氷水 (200 ml) に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、目的物 0.10 g を得た。無色固体。

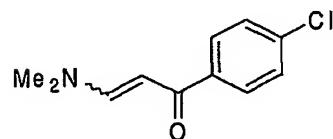
(4) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシカルボニルフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 7) の合成



2-クロロ-5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン-4-イル)-4-フルオロ安息香酸 (0.10 g) に塩化チオニル (2 ml) を加え、2時間加熱還流した。過剰の塩化チオニルを留去した後、メタノール (5 ml) を加え、3時間加熱還流した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 0.04 g を得た。油状物質。

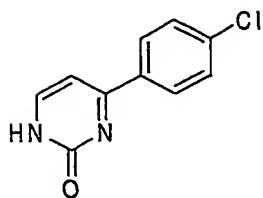
#### [実施例 6]

(1) 3-(4-クロロフェニル)-1-ジメチルアミノプロパン-3-オンの合成



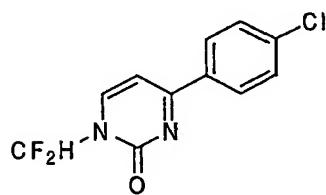
4-クロロアセトフェノン (10 g) に N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール (30 ml) を加え、6時間加熱還流した。過剰の N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールを留去し、得られた固体をジエチルエーテルで洗浄し、目的物 9.5 g を得た。黄色固体。

## (2) 4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-2-オンの合成



3-(4-クロロフェニル)-1-ジメチルアミノプロパン-3-オン (5.0 g) の 1, 2-ジメトキシエタン (50 ml) 溶液に、尿素 (3.6 g) とナトリウムメトキシド (2.6 g) を加え、12時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去し、水 (200 ml) を加え、酸性になるまで 12 規定塩酸を加えた。析出した固体をろ取し、水及びジエチルエーテルで順次洗浄し、目的物 2.0 g を得た。無色固体。

## (3) 4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-2-オン (本発明化合物 N o. 64) の合成

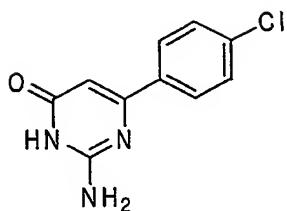


4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-2-オン (2.0 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (20 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (3.0 g)、炭酸カリウム (1.5 g) と炭酸セシウム (0.50 g) を加え、100 °C で 2 時間攪拌した。反応混合物を氷水 (300 ml) に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 0.60 g を得た。融点 164-166 °C。

また、副生物として 0.80 g の 4-(4-クロロフェニル)-2-ジフルオロメトキシピリミジンを得た。融点 112-114 °C

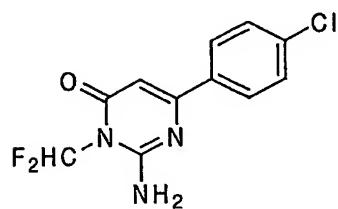
## 〔実施例 7〕

## (1) 2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オンの合成



4-クロロベンゾイル酢酸エチル (20.0 g) とグアニジン塩酸塩 (12.6 g) のエタノール (400 ml) 懸濁液に、氷冷下、ナトリウムメトキシド (11.9 g) を加えた後、6時間還流した。溶媒留去後、残渣に氷水 (400 ml) を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 16.0 g を得た。無色固体。

(2) 2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 5) の合成



2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オン (10.0 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (30 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (27.5 g)、1, 2-ジメトキシエタン (30 ml)、水素化リチウム (0.50 g) を加え、ゆっくり加熱した。約 80 °C にて発泡がはじまった。発泡終了後、0.5 時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン = 2/7) で精製し、目的物 3.50 g を得た。融点 136–138 °C。

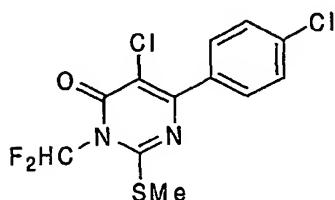
(3) 2-アミノ-5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 6) の合成



2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (2.0 g) のクロロホルム (70 ml) 溶液に、氷冷下、tert-ブチルハイポクロライト (1.2 g) を滴下した。室温で2時間攪拌後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液；酢酸エチル／ヘキサン = 2 / 8）で精製し、目的物 1.1 gを得た。融点 171 - 173 °C。

#### [実施例 8]

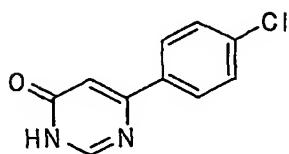
5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルチオピリミジン-6-オン（本発明化合物 N o. 23）の合成



ジメチルジスルファイド (30 g) に 2-アミノ-5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (0.80 g) と 亜硝酸 tert-ブチル (0.32 g) を加え、80 °Cにて1.5時間攪拌した。ジメチルジスルファイドを留去して得られた残渣をシリカゲル分取薄層板（展開溶媒；酢酸エチル／ヘキサン = 2 / 8）で精製し、目的物 0.35 gを得た。融点 107 - 109 °C。

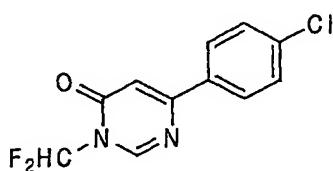
#### [実施例 9]

(1) 4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オンの合成



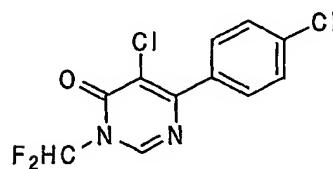
4-クロロベンゾイル酢酸エチル (10 g) とホルムアミジン塩酸塩 (5. 4 g) のエタノール (250 ml) 懸濁液に、氷冷下、ナトリウムメトキシド (6. 0 g) を加え、8時間還流した。溶媒留去後、残渣に冰水 (250 ml) を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 5. 5 g を得た。無色固体。

(2) 4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オン (5. 0 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (20 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (15 g)、1, 2-ジメトキシエタン (20 ml)、水素化リチウム (0. 29 g) を加え、ゆっくり加熱した。約80°Cにて発泡がはじまつた。発泡終了後、1時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に冰水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 1. 6 g を得た。無色固体。

(3) 5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物No. 18) の合成

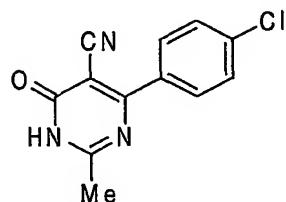


4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (1. 5 g) のクロロホルム (70 ml) 溶液に、氷冷下、tert-ブチルハイポクロライト (0. 95 g) を加えた。室温で2時間攪拌後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン = 2/8)

で精製し、目的物 0.80 g を得た。融点 59 - 61 °C。

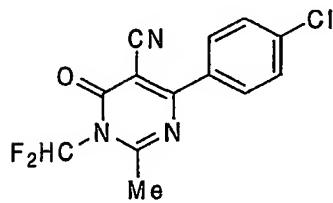
[実施例 10]

(1) 4-(4-クロロフェニル)-5-シアノ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



メチルN-アセチル-4-クロロベンズイミデート(10 g)のメタノール(200 ml)溶液に、シアノ酢酸アミド(4.0 g)とナトリウムメトキシド(2.6 g)を加え、3時間還流した。溶媒留去後、残渣に水(100 ml)とジイソプロピルエーテル(50 ml)を加え抽出し、得られた水層に、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。析出した固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 2.2 g を得た。無色固体。

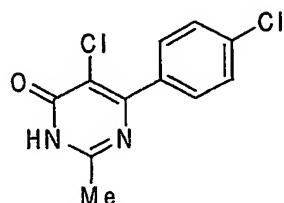
(2) 4-(4-クロロフェニル)-5-シアノ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物 No. 34)の合成



4-(4-クロロフェニル)-5-シアノ-2-メチルピリミジン-6-オン(2.0 g)のN,N-ジメチルホルムアミド(10 ml)溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル(5.0 g)、1,2-ジメトキシエタン(20 ml)、水素化リチウム(0.10 g)を加え、ゆっくり加熱した。約80 °Cにて0.25時間攪拌した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン = 2/8)で精製し、目的物 0.30 g を得た。融点 154 - 156 °C。

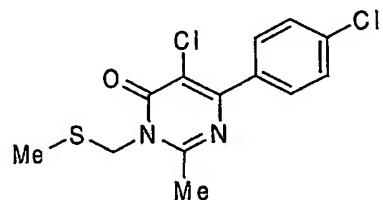
## 〔実施例 1 1〕

(1) 5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-クロロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (10 g) の酢酸 (100 ml) 溶液に N-クロロコハク酸イミド (6.6 g) を加え、120°Cにて、0.5時間攪拌した。減圧下、溶媒留去後、残渣を酢酸エチルに溶解し、水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液；酢酸エチル）で精製し、目的物 7.0 gを得た。無色固体。

(2) 5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-2-メチル-1-メチルチオメチルピリミジン-6-オン（本発明化合物 N o. 26）の合成

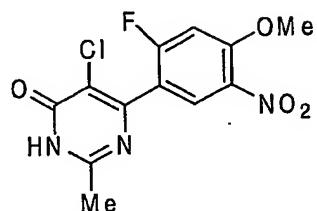


5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.50 g) の 1, 2-ジメトキシエタン (20 ml) 溶液にクロロメチルメチルスルフィド (0.28 g) を加え、氷冷下、水素化リチウム (0.02 g) を加えた。室温で 3 時間攪拌後、溶媒留去し、残渣に水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板（展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン = 2/8）で精製し、目的物 0.22 gを得た。融点 105-107°C。

## 〔実施例 1 2〕

(1) 5-クロロ-4-(2-フルオロー-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)

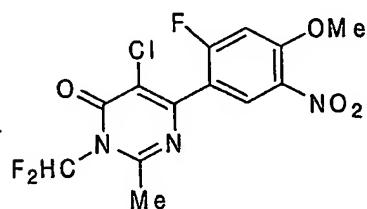
## -2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.51 g) のテトラヒドロフラン (4 ml) 溶液に、ナトリウムメトキシド (0.23 g) を加え、室温で 12 時間攪拌した。水 (30 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液にて順次洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、粗製の目的物 0.42 g を得た。

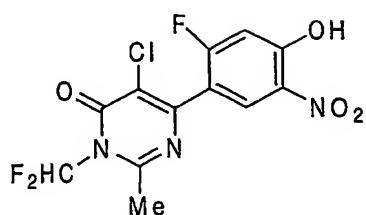
黄色固体。

## (2) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



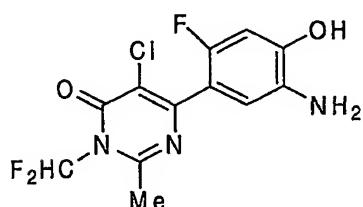
5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.42 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (3 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (1.1 g)、1,2-ジメトキシエタン (3 ml)、水素化リチウム (0.04 g) を加え、100°C にて 4 分間攪拌した。減圧下、溶媒留去し、残渣に水 (10 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を 3 規定塩酸、水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 0.16 g を得た。油状物質。

## (3) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



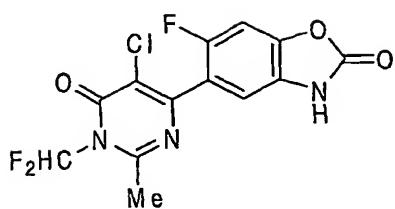
5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロー-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0. 16 g) の塩化メチレン (3 ml) 溶液に、0 °C にて三臭化ホウ素 (0. 12 ml) を加え、室温で 0. 75 時間攪拌した。氷水 (1 ml) とクロロホルム (20 ml) を加え、室温で攪拌後、不溶物をろ別した。得られたクロロホルム溶液を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣を n-ヘキサンで洗浄、乾燥し、目的物 0. 13 g を得た。黄色固体。

(4) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(5-アミノ-2-フルオロー-4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



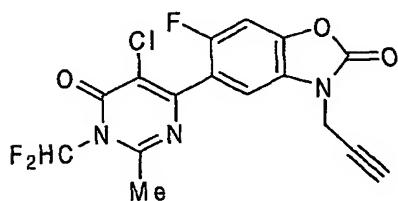
酢酸エチル (2 ml)、酢酸 (1 ml) と水 (2 ml) の混合液に、鉄粉 (0. 086 g) を加え、還流しながら、5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロー-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0. 13 g) の酢酸エチル (2 ml) 溶液を滴下した。滴下終了後、さらに 0. 75 時間還流した。不溶物をろ別後、ろ液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣を n-ヘキサンで洗浄、乾燥し、目的物 0. 10 g を得た。樹脂状物質。

(5) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(6-フルオロベンゾオキサゾロン-5-イル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(5-アミノ-2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.10 g) のアセトニトリル (2 ml) 溶液に、N, N'-ジスクシンイミジルカーボネート (0.12 g) を加え、室温で1時間攪拌した。水 (20 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、目的物 0.11 g を得た。無色固体。

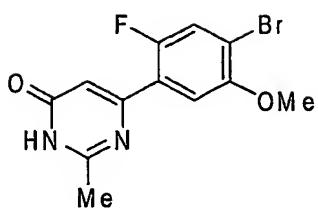
(6) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(6-フルオロ-3-プロパルギルベンゾオキサゾロン-5-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 62) の合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(6-フルオロベンゾオキサゾロン-5-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.11 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、プロパルギルブロミド (0.06 g) と炭酸カリウム (0.09 g) を加え、室温で12時間攪拌した。不溶物をろ別後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒；酢酸エチル/n-ヘキサン = 3/7) で精製し、目的物 0.07 g を得た。融点 160-161°C

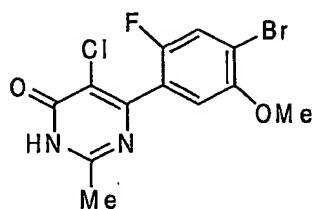
### [実施例 13]

(1) 4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 50) の合成



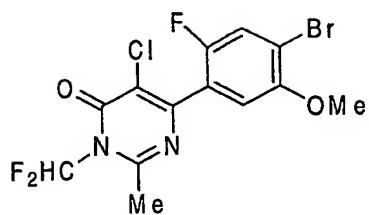
4-ブロモ-2-フルオロー-5-メトキシベンゾイル酢酸エチル (20.0 g) のエタノール (400 ml) 溶液に、アセトアミジン塩酸塩 (8.90 g) とナトリウムメトキシド (8.50 g) を加え、6時間還流した。溶媒留去後、残渣に氷水 (200 ml) を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥することにより、目的物 14.2 g を得た。融点 297–300 °C。

(2) 4-(4-ブロモ-2-フルオロー-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



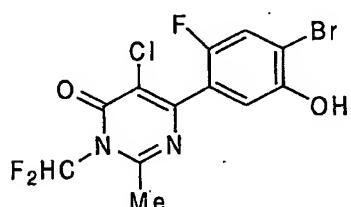
4-(4-ブロモ-2-フルオロー-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (14.0 g) の酢酸 (200 ml) 溶液に N-クロロコハク酸イミド (6.60 g) を加え、120 °C にて、0.5 時間攪拌した。減圧下、溶媒留去後、残渣を酢酸エチルに溶解し、水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；酢酸エチル) で精製し、目的物 14.5 g を得た。無色固体。

(3) 4-(4-ブロモ-2-フルオロー-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 N o. 51) の合成



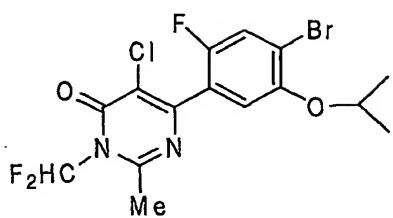
4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オン (15 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (100 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (25 g)、1, 2-ジメトキシエタン (100 ml)、水素化リチウム (0.50 g) を加え、ゆっくり加熱した。80°C付近での発泡がおさまった後、さらに0.5時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水 (200 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；酢酸エチル/n-ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 5.5 gを得た。融点 116-117°C。

(4) 4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



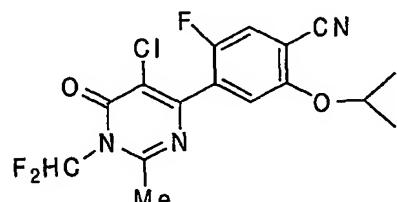
4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (5.0 g) の塩化メチレン (100 ml) 溶液に、0°Cにて三臭化ホウ素 (11 g) を加え、室温で18時間攪拌した。反応液を氷水 (200 ml) に加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 3.3 gを得た。無色固体。

(5) 4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-ブロモ-2-フルオロー-5-ヒドロキシフェニル)-5-クロロー-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (3. 3 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、ヨウ化イソプロピル (3. 6 g) と無水炭酸カリウム (1. 8 g) を加え、2 時間還流した。溶媒留去後、水 (100 ml) を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、短いアルミナカラムを通過させた後、溶媒留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルで再結晶し、目的物 2. 8 g を得た。無職個体。

(6) 4-(4-シアノ-2-フルオロー-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロー-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 N o. 53) の合成

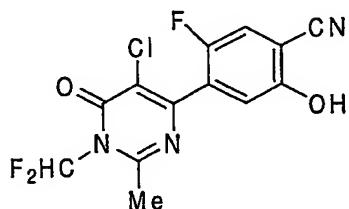


4-(4-ブロモ-2-フルオロー-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロー-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (2. 0 g) の N-メチル-2-ピロリドン (25 ml) 溶液に、シアノ化第一銅 (0. 84 g) とヨウ化第一銅 (0. 20 g) を加え、窒素置換した後、155°C にて 4 時間攪拌した。0°C まで冷却後、6 規定塩酸 (5 ml) を加え、0. 25 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル (100 ml) と水 (100 ml) の混合液にあけ、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 0. 70 g を得た。

樹脂状物質。

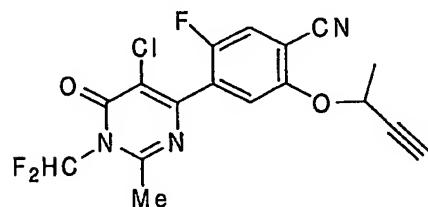
[実施例 14]

(1) 5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (0.70 g) の塩化メチレン (30 ml) 溶液に、0°Cにて三臭化ホウ素 (1.4 g) を加え、室温で18時間攪拌した。反応液を氷水 (30 ml) に加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 0.5 gを得た。無色固体。

(2) 5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-(1-メチルプロパルギルオキシ)フェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物No. 52) の合成

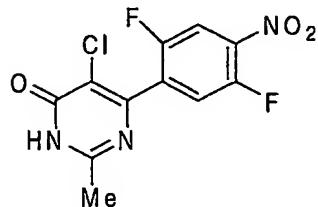


5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (0.40 g) のアセトニトリル (30 ml) 溶液に、1-メチルプロパルギルメチルスルホネート (0.36 g)、無水炭酸カリウム (0.25 g) とヨウ化カリウム (0.06 g) を加え、3時間還流した。溶媒留去後、水 (30 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン = 3 /

7) で精製し、目的物 0. 35 g を得た。樹脂状物質。

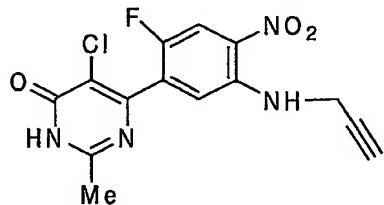
[実施例 15]

(1) 5-クロロ-4-(2, 5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



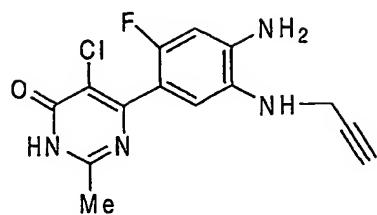
5-クロロ-4-(2, 5-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (10 g) の濃硫酸 (40 ml) 溶液に、氷冷下、発煙硝酸 ( $d = 1.52$ 、8 ml) をゆっくり滴下し、室温で 12 時間攪拌した。反応液を氷水 (300 ml) に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 7. 5 g を得た。黄色固体。

(2) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ニトロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



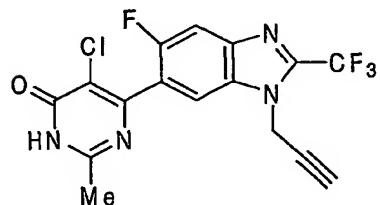
5-クロロ-4-(2, 5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (3. 0 g) のテトラヒドロフラン (30 ml) 溶液にプロパルギルアミン (1. 1 g) とトリエチルアミン (3. 0 g) を加え、室温で 12 時間攪拌した。溶媒留去後、水 (50 ml) と濃塩酸 (3 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、粗製の目的物 3. 1 g を得た。黄色固体。

(3) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



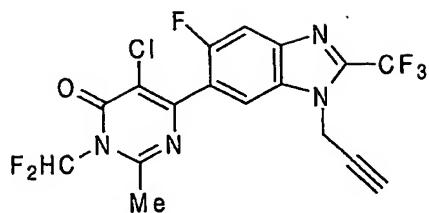
5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ニトロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (1. 2 g) の酢酸エチル (15 ml) 溶液に酢酸 (2 ml)、水 (20 ml) と鉄粉 (0. 80 g) を加え、3 時間還流した。不溶物をろ別後、ろ液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、粗製の目的物 1. 2 g を得た。樹脂状物質。

(4) 5-クロロ-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オン (1. 0 g) をトリフルオロ酢酸 (15 ml) に溶かし、2 時間還流した。溶媒留去して得られた残渣に水 (20 ml) を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン = 4/6) で精製し、目的物 0. 60 g を得た。樹脂状物質。

(5) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 N o. 63) の合成

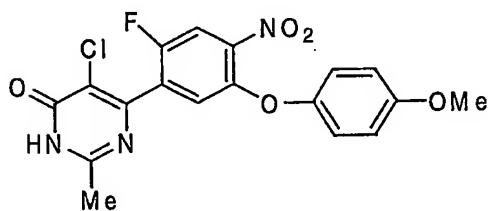


5-クロロ-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0. 6 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (5 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (0. 95 g)、1, 2-ジメトキシエタン (5 ml)、水素化リチウム (0. 02 g) を加え、ゆっくり加熱した。80℃付近での発泡がおさまった後、さらに0. 25時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水 (20 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 0. 20 gを得た。樹脂状物質。

また、副生成物として、5-クロロ-6-ジフルオロメトキシ-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン 0. 19 gを得た。油状物質。

#### [実施例 16]

(1) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成

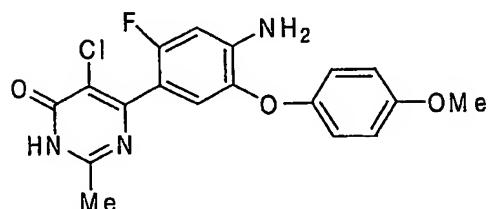


5-クロロ-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (5. 0 g) と 4-メトキシフェノール (4. 8 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (50 ml) 溶液に、0℃にて 60% 水素化ナトリウム (0. 94 g) を加え、室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を水 (200 ml) にあけ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウム

で乾燥後、溶媒留去した。残渣をジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 3.

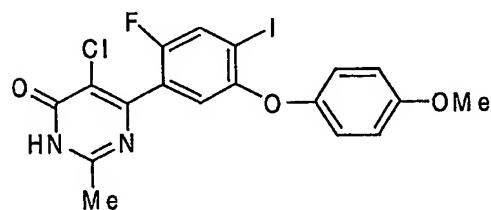
2 g を得た。黄色固体。

(2) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-4-(2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (3. 2 g) の酢酸エチル (30 ml) 溶液に酢酸 (5 ml)、水 (50 ml) と鉄粉 (3. 0 g) を加え、3 時間還流した。不溶物をろ別後、ろ液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄後、乾燥し、目的物 2. 5 g を得た。淡黄色固体。

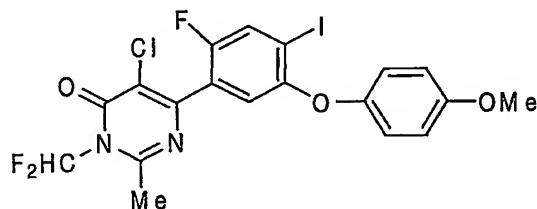
(3) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オン (2. 5 g) のアセトン (20 ml) 溶液に 12 規定塩酸 (8 ml)、水 (10 ml) 及びヨウ化カリウム (2. 0 g) を加え、氷冷下、亜硝酸ナトリウム (1. 1 g) の水 (4 ml) 溶液を滴下した。室温で 0. 5 時間攪拌後、反応混合物を氷水 (50 ml) 及びジエチルエーテル (50 ml) の混合液中に注いだ。激しく攪拌しながら亜硫酸水素ナトリウムをヨウ素の色が消えるまで加えた。エーテル層を分離し、水洗、無水

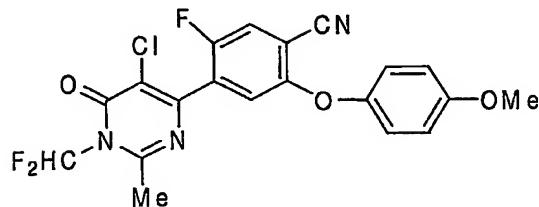
硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥して目的物 2. 1 g を得た。無色固体。

(4) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2. 1 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (10 ml) 溶液に、ブロモジフルオロ酢酸エチル (2. 9 g)、1, 2-ジメトキシエタン (10 ml)、水素化リチウム (0. 06 g) を加え、ゆっくり加熱した。80 °C付近での発泡がおさまった後、さらに 0. 25 時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水 (50 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；酢酸エチル/ヘキサン = 1 / 9) で精製し、目的物 1. 7 g を得た。淡黄色固体。

(5) 5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 60) の合成

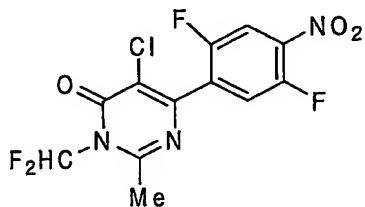


5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (1. 6 g) の N-メチル-2-ピロリドン (20 ml) 溶液に、シアノ化第一銅 (

0.52 g) を加え、窒素置換した後、150℃にて3時間攪拌した。0℃まで冷却後、12規定塩酸(3ml)を加え、0.25時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル(50ml)と水(50ml)の混合液にあけ、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン=2/8)で精製し、目的物0.35gを得た。融点146-148℃。

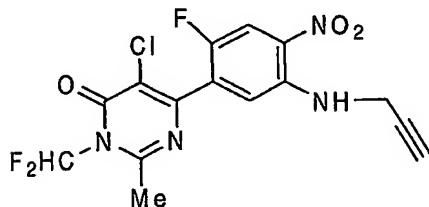
[実施例17]

(1) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,5-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(3.0g)の濃硫酸(20ml)溶液に、氷冷下、発煙硝酸(d=1.52、2ml)をゆっくり滴下し、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水(100ml)に注ぎ、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液；酢酸エチル/ヘキサン=2/8)で精製し、目的物2.2gを得た。淡黄色固体。

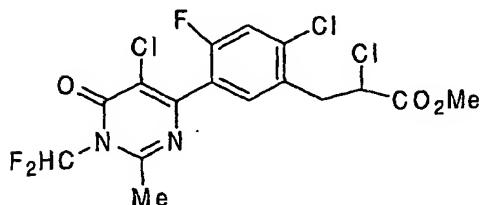
(2) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ニトロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No.54)の合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,5-ジフルオロー-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(2.0g)のテトラヒドロフラン(30ml)溶液にプロパルギルアミン(0.63g)とトリエチルアミン(1.2g)を加え、室温で12時間攪拌した。溶媒留去後、水(50ml)を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルに溶解し、短いシリカゲルカラムを通し、溶媒留去し、目的物1.6gを得た。樹脂状物質。

[実施例18]

3-(5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチル-6-オキソビドロピリミジン-4-イル)-2-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-クロロプロピオニ酸メチル(本発明化合物No. 65)の合成

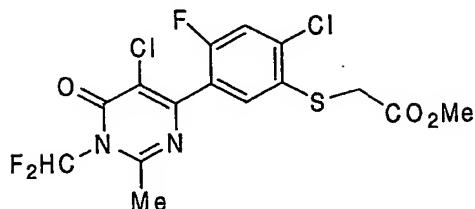


アクリル酸メチル(1.1g)のアセトニトリル(20ml)溶液に亜硝酸ターシャリーブチル(0.96g)と塩化第二銅(0.91g)を加え、0℃にて、4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(2.1g)のアセトニトリル(10ml)溶液を滴下した。室温で40分間攪拌後、溶媒留去した。得られた残渣に3規定塩酸(50ml)を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を3規定塩酸、水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液；酢酸エチル/ヘキサン=1/5)で精製し、目的物0.64gを得た。油状物質。

[実施例19]

3-(5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチル-6-オキソビドロピリミジン-4-イル)-2-クロロ-4-フルオロフェニルチオ)酢酸メ

## チル（本発明化合物 N o. 70）の合成



4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-(ジフルオロメチル)-2-メチルピリミジン-6-オン (1.2 g) に 35% 塩酸 (1.0 ml) を加え、50℃にて0.5時間攪拌した。室温まで冷却後、アセトン (10 ml)、水 (8 ml) とチオグリコール酸メチル (0.91 ml) を加え、0℃にて、亜硝酸ナトリウム (0.70 g) の水 (2 ml) 溶液を滴下した。室温で3時間攪拌後、水 (50 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液；酢酸エチル／ヘキサン = 1/5）で精製し、目的物 0.16 g を得た。融点 126 - 128℃。

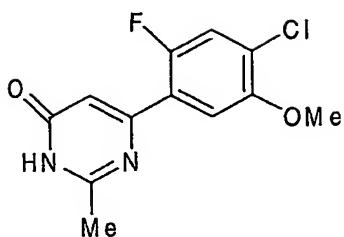
## 〔実施例 20〕

(1) (4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシベンゾイル) 酢酸エチルの合成



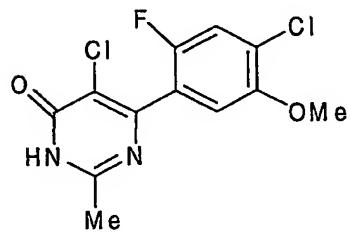
原料に 4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシベンゾイルクロリド (21.9 g) を使用し、実施例 1 の (1) と同様にして目的物 18.5 g を得た。融点 63 - 64℃。

(2) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



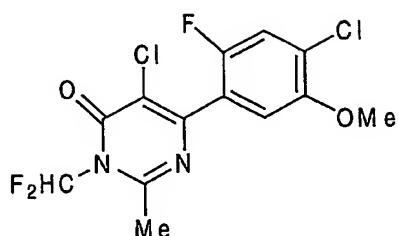
原料に(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシベンゾイル)酢酸エチル(13.8 g)を使用し、実施例1の(2)と同様にして目的物9.38 gを得た。無色固体。

(3) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(5.00 g)の酢酸(170 ml)溶液にN-クロロコハク酸イミド(2.70 g)を加え、120°Cにて、1時間攪拌した。反応液を室温まで冷却後、水(300 ml)にあけ、クロロホルムで抽出した。有機層を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液、塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒留去して目的物5.32 gを得た。融点258-264°C。

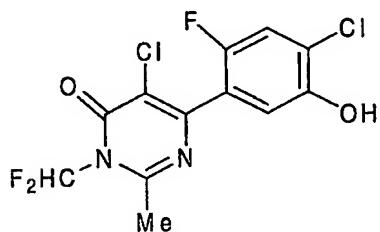
(4) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 40)の合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (5.32 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (50 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (35.6 g)、1, 2-ジメトキシエタン (50 ml) と水素化リチウム (1.39 g) を加え、攪拌しながら100°Cにて5分間加熱した。室温まで冷却後、水 (500 ml) にあけ、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液；ヘキサン/酢酸エチル = 4/1) で精製し、目的物 1.25 gを得た。融点 130-131°C。

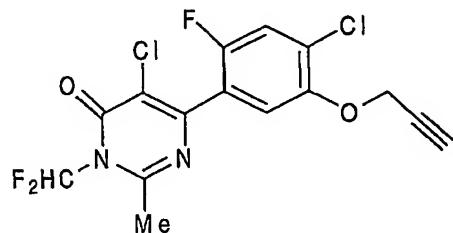
[実施例 21]

(1) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 73) の合成



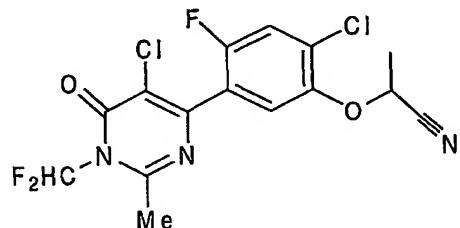
5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (0.30 g) の塩化メチレン (10 ml) 溶液に、0°Cにて三臭化ホウ素 (0.51 g) を加えた。室温にて1.5時間攪拌後、水 (20 ml) を加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒留去し、目的物 0.30 gを得た。油状物質。

(2) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-プロパルギルオキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 41)の合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン(0.13g)のアセトニトリル(10ml)溶液に無水炭酸カリウム(0.065g)とプロパルギルブロミド(0.052g)を加え、1時間還流した。室温まで冷却後、水(20ml)を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液；ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製して目的物0.84gを得た。融点124-125℃。

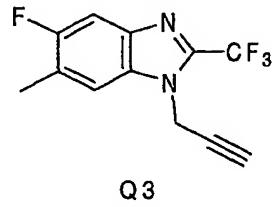
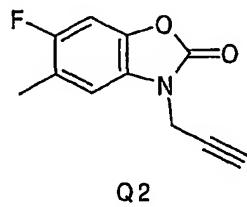
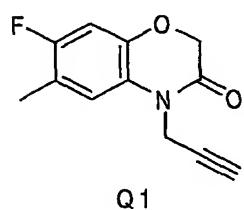
(3) 2-(5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチル-6-オキソヒドロピリミジン-4-イル)-2-クロロ-4-フルオロフェノキシ)プロパンニトリル(本発明化合物No. 94)の合成



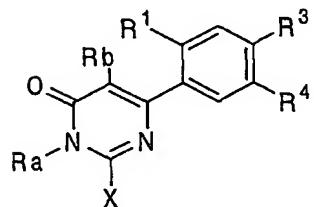
5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン(0.20g)のテトラヒドロフラン(2.5ml)溶液にトリフェニルホスфин(0.39g)、ラクトニトリル(0.11g)とアゾジカルボン酸ジエチル(0.26g)を加えた。室温で18時間攪拌後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄

層板（展開溶媒；酢酸エチル／ヘキサン = 1 / 2）で精製し、目的物 0.16 g を得た。融点 133 - 134 °C。

前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式と物性を前記実施例を含め第1表ないし第3表に示す。但し表中の記号は前記と同様の意味を表し、Q1、Q2 及び Q3 は以下の意味を表す。



〔第1表〕



No.	R <sup>a</sup>	R <sup>b</sup>	X	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性値（融点、°C）
1	CHF <sub>2</sub>	H	Me	H	Cl	H	126-128
2	CHF <sub>2</sub>	Cl	Me	H	Cl	H	97-99
3	CHF <sub>2</sub>	Cl	Me	F	Cl	H	樹脂状物質
4	CHF <sub>2</sub>	Cl	Me	F	Cl	NHSO <sub>2</sub> Me	170-172
5	CHF <sub>2</sub>	H	NH <sub>2</sub>	H	Cl	H	136-138
6	CHF <sub>2</sub>	Cl	NH <sub>2</sub>	H	Cl	H	171-173
7	CHF <sub>2</sub>	Cl	Me	F	Cl	CO <sub>2</sub> Me	油状物質
8	H	H	Me	F	Cl	H	>280 (分解)
9	CHF <sub>2</sub>	H	Me	F	Cl	H	95-96
10	H	H	Me	F	F	H	>250 (分解)
11	CHF <sub>2</sub>	H	Me	F	F	H	91-92

12	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	150-152
13	Me	H	Me	H	C1	H	152-154
14	Me	C1	Me	H	C1	H	215-217
15	iso-Pr	C1	Me	H	C1	H	91-93
16	$\text{MeOCH}_2$	C1	Me	H	C1	H	104-106
17	$\text{MeOCH}_2$	H	Me	H	C1	H	92-94
18	$\text{CHF}_2$	C1	H	H	C1	H	59-61
19	$\text{CHF}_2$	C1	Me	H	C1	H	85-87
20	H	C1	Me	H	C1	H	294-296
21	H	H	Me	F	Br	H	>270 (分解)
22	$\text{CHF}_2$	H	Me	F	Br	H	107-108
23	$\text{CHF}_2$	C1	MeS	H	C1	H	107-109
24	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	Br	H	油状物質
25	$\text{CH}\equiv\text{CCH}_2$	C1	Me	H	C1	H	133-135
26	$\text{MeSCH}_2$	C1	Me	H	C1	H	105-107
27	$\text{MeSO}_2\text{CH}_2$	C1	Me	H	C1	H	224-226
28	$\text{MeOCO}$	C1	Me	H	C1	H	125-127
29	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	I	101-102
30	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	CN	124-125
31	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	Br	NH <sub>2</sub>	54-55
32	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	Br	$\text{NHSO}_2\text{Et}$	149-151
33	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{N}(\text{C}(\text{O})(\text{tert-Bu}))\text{SO}_2\text{Et}$	64-65
34	$\text{CHF}_2$	CN	Me	H	C1	H	154-156
35	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{NHSO}_2\text{Et}$	169-170
36	$\text{CF}_2\text{CH}_2$	C1	Me	H	C1	H	123-125
37	$\text{CH}_2\text{F(CH}_2)_2$	C1	Me	H	C1	H	114-116
38	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{N}(\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Cl})_2$	187-188
39	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	172-173
40	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	OMe	130-131

41	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	124-125
42	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{OCH}_2\text{OMe}$	121-122
43	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$	98-99
44	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$	128-129
45	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{OCH}_2\text{CMe}(=\text{NOMe})$	104-106
46	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$	93-94
47	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	$\text{NO}_2$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	油状物質
48	$\text{CHF}_2$	$\text{CH}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$	Me	F	$\text{NO}_2$	F	油状物質
49	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CO}_2(\text{iso-Pr})$	油状物質
50	H	H	Me	F	Br	OMe	297-300
51	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	Br	OMe	116-117
52	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{OCHMeC}\equiv\text{CH}$	樹脂状物質
53	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	O(iso-Pr)	樹脂状物質
54	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	$\text{NO}_2$	$\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	樹脂状物質
55	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	樹脂状物質
56	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{OCH}_2\text{OMe}$	樹脂状物質
57	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	O(cyclo-Pen)	樹脂状物質
58	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$	127-129
59	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	$\text{OCMe}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	133-135
60	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	CN	O(4-MeO-Ph)	146-148
65	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{Me}$	油状物質
66	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH}_2\text{CHClCOMe}$	油状物質
67	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{Et}$	油状物質
68	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH}_2\text{CHClSO}_2\text{Ph}$	63-65
69	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMe}_2$	57-59
70	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$	126-128
71*	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH=CClCO}_2\text{Et}$	油状物質
72	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	$\text{CH}_2\text{CHClCN}$	76-78
73	$\text{CHF}_2$	C1	Me	F	C1	OH	油状物質

74	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CMeC1CO <sub>2</sub> Me	油状物質
75	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHBrCO <sub>2</sub> Me	34-36
76	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHClCH <sub>2</sub> Cl	油状物質
77	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHClCO(O)Me	35-37
78	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	108-109
79	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OPr	91-92
80	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> Ph	油状物質
81	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -Ph)	油状物質
82	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> H	138-140
83	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	油状物質
84	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> (iso-Pr)	油状物質
85	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	油状物質
86	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH=CHMe	90-91
87	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OC(O)CH=CMe <sub>2</sub>	127-129
88	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OC(O)Me	105-107
89	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OC(O)CH <sub>2</sub> Cl	油状物質
90	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OC(O)CH <sub>2</sub> OMe	油状物質
91	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH=CH <sub>2</sub>	101-102
92	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	100-102
93	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CN	油状物質
94	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCHMeCN	油状物質
95	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	O(2,3-エボ <sup>°</sup> キシフ <sup>°</sup> ロヒ <sup>°</sup> ル)	144-146
96	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OEt	113-115
97	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (cyclo-Pen)	油状物質
98	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (cyclo-Bu)	油状物質
99	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (テトラヒト <sup>°</sup> ロフラン-3-イル)	油状物質
100	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>	99-101
101	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (3-メチルオキセタン-3-イル)	油状物質
102	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (cyclo-Pr)	油状物質

103	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	132-133
104	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	油状物質
105	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	O(sec-Bu)	油状物質
106	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMe(cyclo-Pr)	油状物質
107	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> Bu	油状物質
108	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> (iso-Bu)	油状物質
109	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> (tert-Bu)	油状物質
110	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> (cyclo-Hex)	油状物質
111	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	油状物質
112	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	油状物質
113	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	油状物質
114	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH <sub>2</sub>	164-166
115	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CMeClC(0)NMe <sub>2</sub>	油状物質
116	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)(モルホリン-1-イル)	64-66
117	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (テトラヒドロフラン-2-イル)	油状物質
118	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC(0)Me	油状物質
119	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (モルホリン-1-イル)	油状物質
120	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCH=CH <sub>2</sub>	油状物質
121	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	O(cyclo-Pen)	油状物質
122	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OSO <sub>2</sub> Me	185-187
123	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> (2,2-シメチル-1,3-シオキソラン-4-イル)	油状物質
124	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCH <sub>2</sub> OMe	油状物質
125	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCH <sub>2</sub> C≡CH	油状物質
126	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (ヒドロシリソノ-1-イル)	油状物質
127	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr	114-115
128	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> (テトラヒドロフラン-2-イル)	油状物質
129	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClP(O)(OEt) <sub>2</sub>	油状物質
130	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClCO <sub>2</sub> Pr	油状物質
131	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> (2-クロロブタノリト-2-イル)	油状物質

132	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CCl <sub>2</sub> CN	油状物質
133	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClSO <sub>2</sub> Me	油状物質
134	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHBrC(0)NMe <sub>2</sub>	油状物質
135	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHMe	54-56
136	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	油状物質
137	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> (テトラヒドロフラン-3-イル)	油状物質
138	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OC(0)NMe <sub>2</sub>	150-152
139	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCO <sub>2</sub> Me	油状物質
140**	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCO <sub>2</sub> Me	油状物質
141***	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHMeCO <sub>2</sub> Me	油状物質
142	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-ヒドロトリノニル)	油状物質
143	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	85-87
144	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	O(4-フタノリトノ-2-イル)	油状物質
145	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHOMe	68-71
146	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(0)NMe <sub>2</sub>	油状物質
147	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OC(0)Et	107-108
148	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OC(0)CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	145-146
149	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHET	148-150
150	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH(iso-Pr)	157-159
151	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH(iso-Bu)	93-95
152	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH(sec-Bu)	105-107
153	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH(tert-Bu)	65-67
154	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH(cyclo-Pr)	179-181
155	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NH(cyclo-Hex)	92-95
156	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHCH <sub>2</sub> C≡CH	52-54
157	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	45-47
158	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	148-152
159	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	63-65
160	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHClC(0)NHCH(iso-Pr)CO <sub>2</sub> Me	47-50

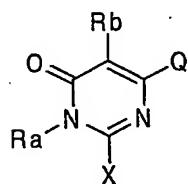
161	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NHNMe <sub>2</sub>	168-171
162	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NH(モルホリン-1-イル)	107-109
163	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NHPH	53-55
164	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NH(チアソ <sup>+</sup> -ル-2-イル)	58-60
165	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NH(5-メチルイソオキサソ <sup>+</sup> -ル-3-イル)	78-81
166	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NHCH <sub>2</sub> Ph	108-110
167	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NMeBu	43-45
168	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NMe(iso-Bu)	48-51
169	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NMeOMe	油状物質
170	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NEt <sub>2</sub>	41-43
171	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NEtPr	油状物質
172	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NEt(iso-Pr)	35-37
173	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NEtBu	油状物質
174	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NEt(tert-Bu)	油状物質
175	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)N(iso-Pr) <sub>2</sub>	37-39
176	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NPr(sec-Bu)	油状物質
177	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)N(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	油状物質
178	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)N(iso-Pr)(cyclo-Hex)	油状物質
179	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)N(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )(cyclo-Hex)	油状物質
180	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)N(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )(cyclo-Pen)	油状物質
181	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NMePh	油状物質
182	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)NMe(ヒドリシ <sup>+</sup> -2-イル)	70-72
183	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(0)N(ヒドリシ <sup>+</sup> -1-イル)	60-62
184	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(=NOMe)OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	油状物質
185	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> (sec-Bu)	油状物質
186	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	油状物質
187	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CHMeCH=CH <sub>2</sub>	油状物質
188	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	油状物質
189	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CHMeC≡CH	油状物質

190	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (cyclo-Pr)	油状物質
191	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CHC1CH <sub>2</sub> Cl	油状物質
192	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CMeCl	油状物質
193	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	油状物質
194	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCONH <sub>2</sub>	166-170
195	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCO(モルホリン-1-イル)	油状物質
196	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CCl=CH <sub>2</sub>	86-88
197	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCHEtC≡CH	油状物質
198	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCHPrC≡CH	油状物質
199	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH(iso-Bu)C≡CH	油状物質
200	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(O)NMeCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	32-34
201	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(O)N(cyclo-Hex)Ph	58-60
202	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(O)N(4-メチルヒドロシラン-1-イル)	164-167
203	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(O)N(チオモルホリン-1-イル)	50-53
204	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	93-94
205	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (1,5-シナフチルヒドロシラン-1-イル)	199-201
206	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCHFCO <sub>2</sub> Et	油状物質
207	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	油状物質
208	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	114-116
209	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	88-90
210	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCF <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	油状物質
211	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	油状物質
212	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(O)N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl) <sub>2</sub>	油状物質
213	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> (4-MeOCH <sub>2</sub> O-Ph)	油状物質
214	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(=NOMe)OME	油状物質
215	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	CH <sub>2</sub> CHMeCO <sub>2</sub> Me	油状物質
216	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>2</sub> Cl	146-148
217	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	O(1-メチルヒドロシラン-3-イル)	151-153
218	CHF <sub>2</sub>	C1	Me F C1	OCH <sub>2</sub> C(O)NET <sub>2</sub>	134-136

219	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> C(O)(ヒドリシソ-1-イル)	157-159
220	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> C(O)(モルホリン-1-イル)	185-187
221	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> C(O)NMe(CH <sub>2</sub> C≡CH)	油状物質
222	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> C(O)NMe(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )	113-115
223	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	126-128
224	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHC1(=NOMe)OC(O)Me	43-45
225	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> C(O)NHMe	166-168
226	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	122-125
227	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH(CH <sub>2</sub> Cl)CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	油状物質
228	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	CN	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> Me	油状物質
229	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	Br	CH <sub>2</sub> CHC1CO <sub>2</sub> Me	油状物質
230	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(O)NMe(iso-Pr)	45-47
231	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	Me	油状物質
232	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> CHC1C(=NOMe)OCH <sub>2</sub> OMe	油状物質
233	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH(iso-Bu)C≡CH	油状物質
234	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SiMe <sub>3</sub>	油状物質
235	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	CH <sub>2</sub> OMe	84-86
236	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	F	C1	OCHBuC≡CH	油状物質

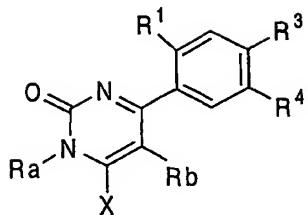
\*) E体とZ体の混合物。\*\*) S体。\*\*\*) R体。

[第2表]



No.	Ra	Rb	X	Q-	物性値（融点、℃）
61	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	Q1	197-199
62	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	Q2	160-161
63	CHF <sub>2</sub>	C1	Me	Q3	樹脂状物質

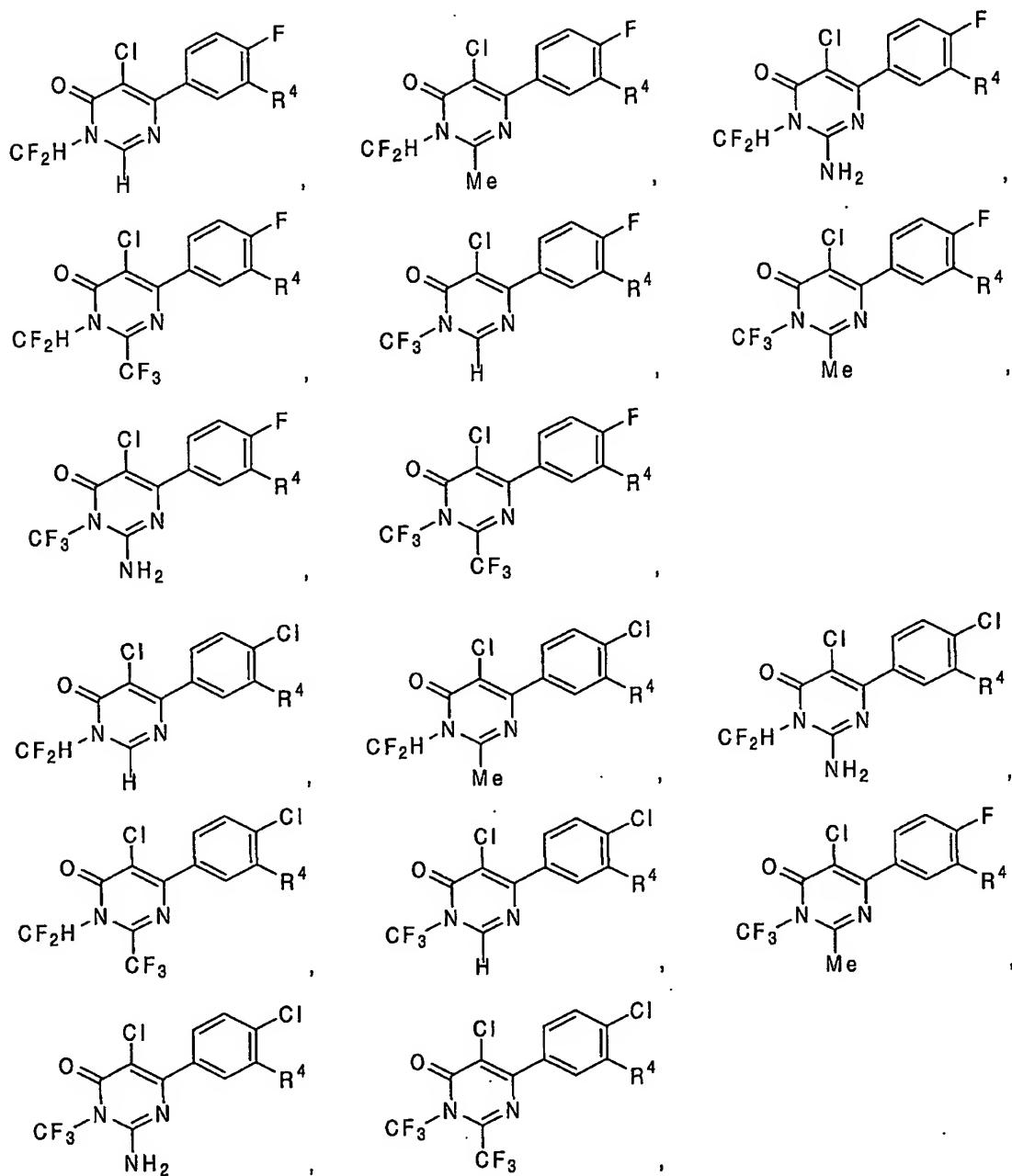
〔第3表〕

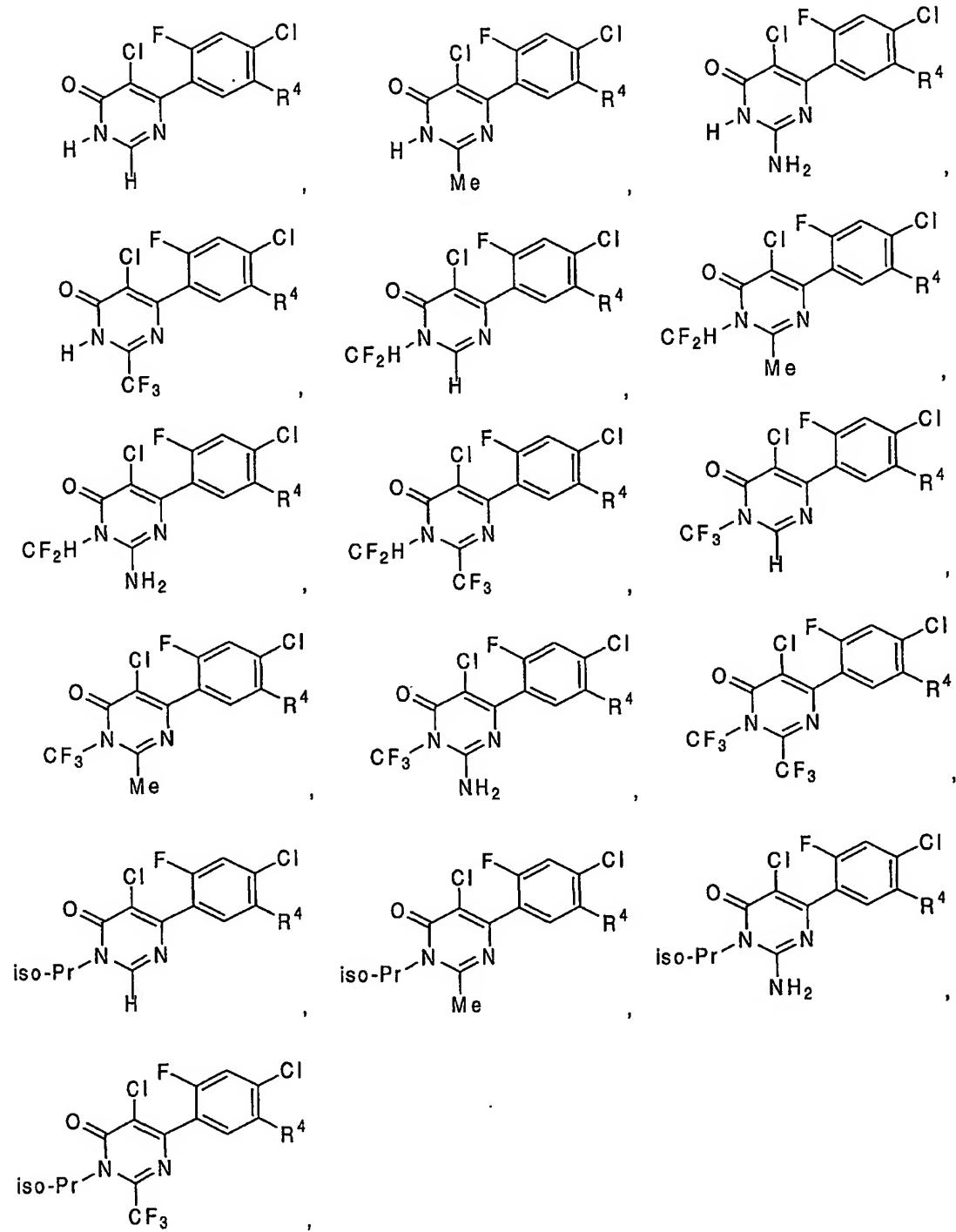


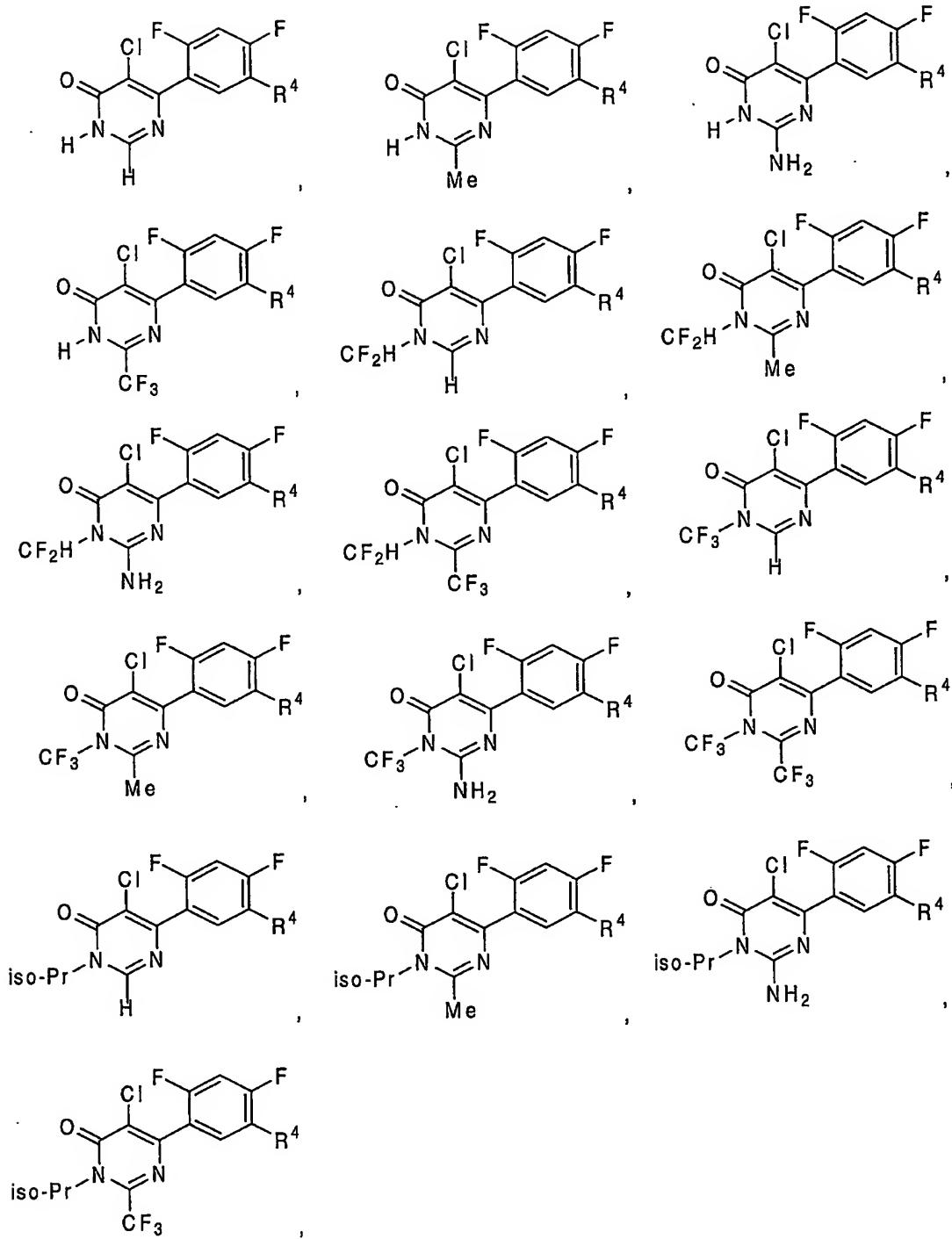
No.	Ra	Rb	X	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性値（融点、℃）
64.	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	Cl	H	164-166

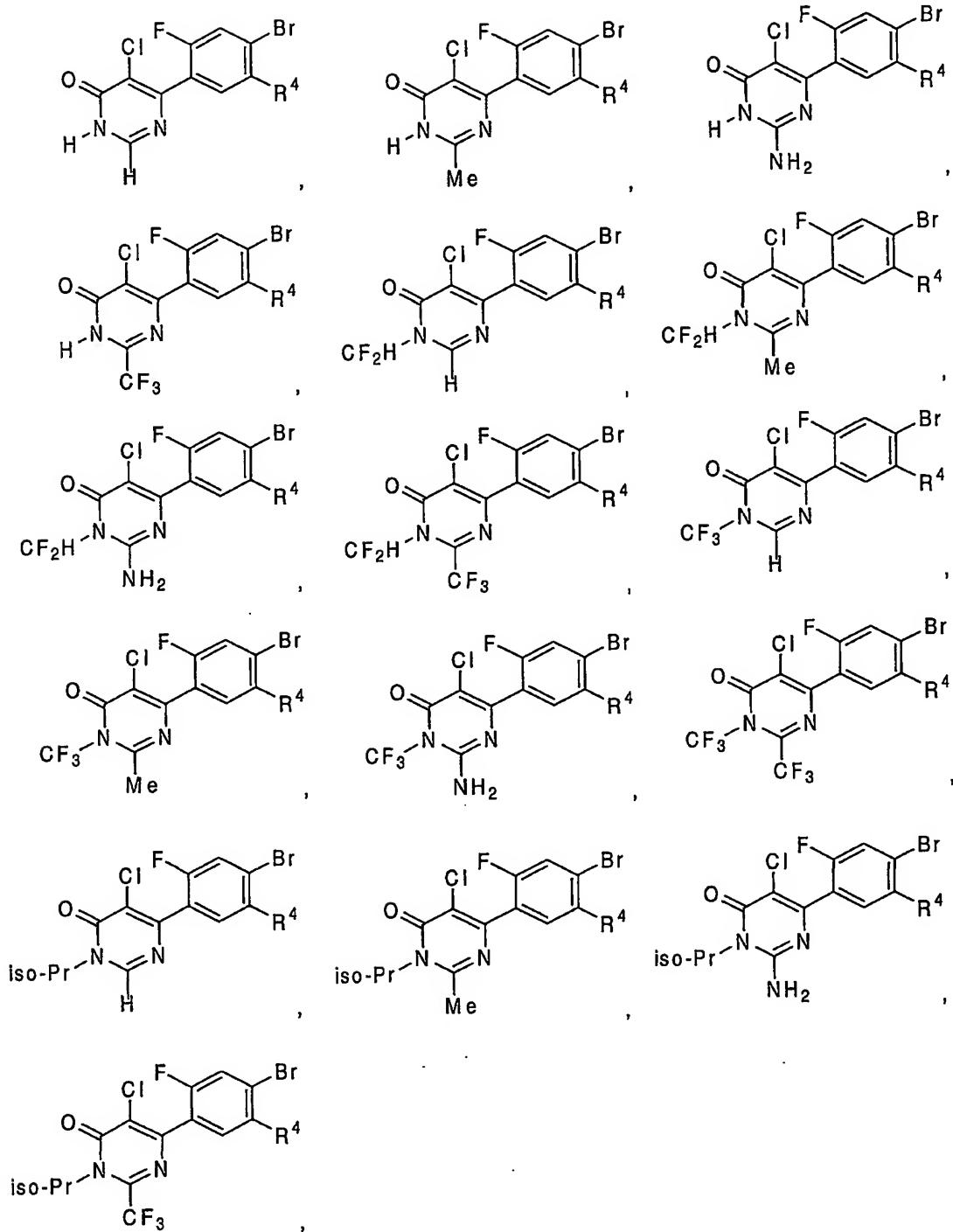
次に、本発明に含まれる化合物の例を、前記実施例で合成した化合物を含め、第4表～第6表に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

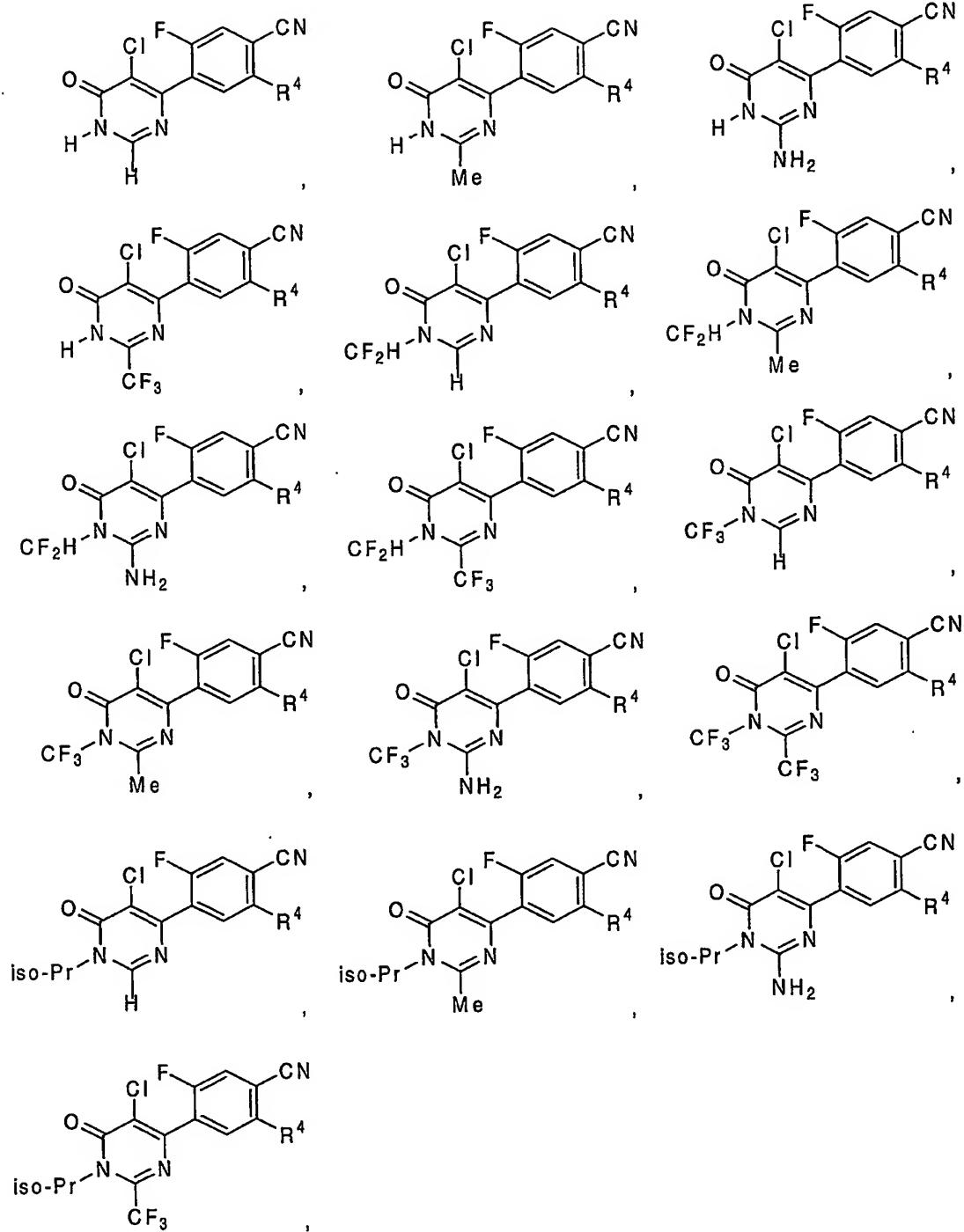
〔第4表〕

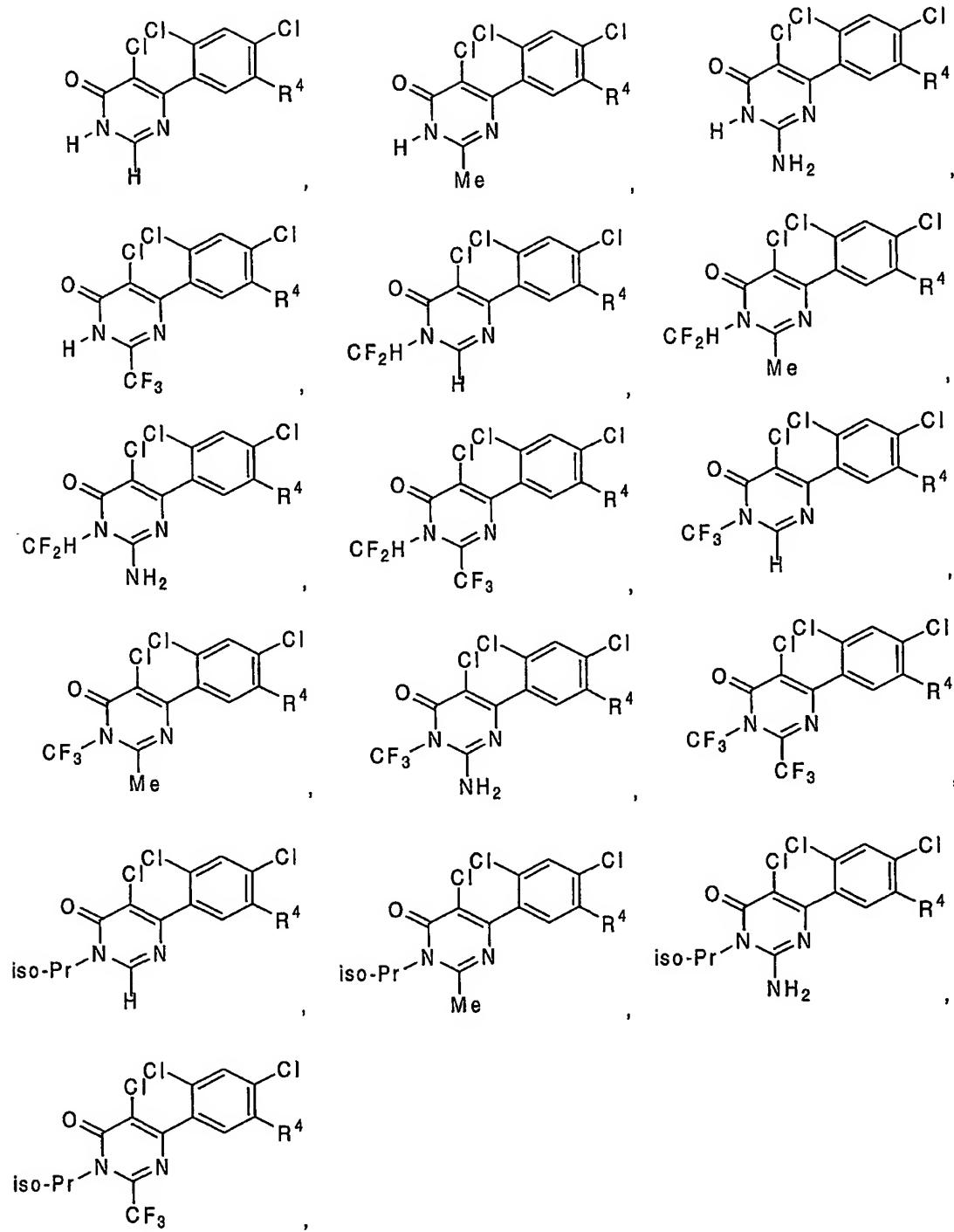


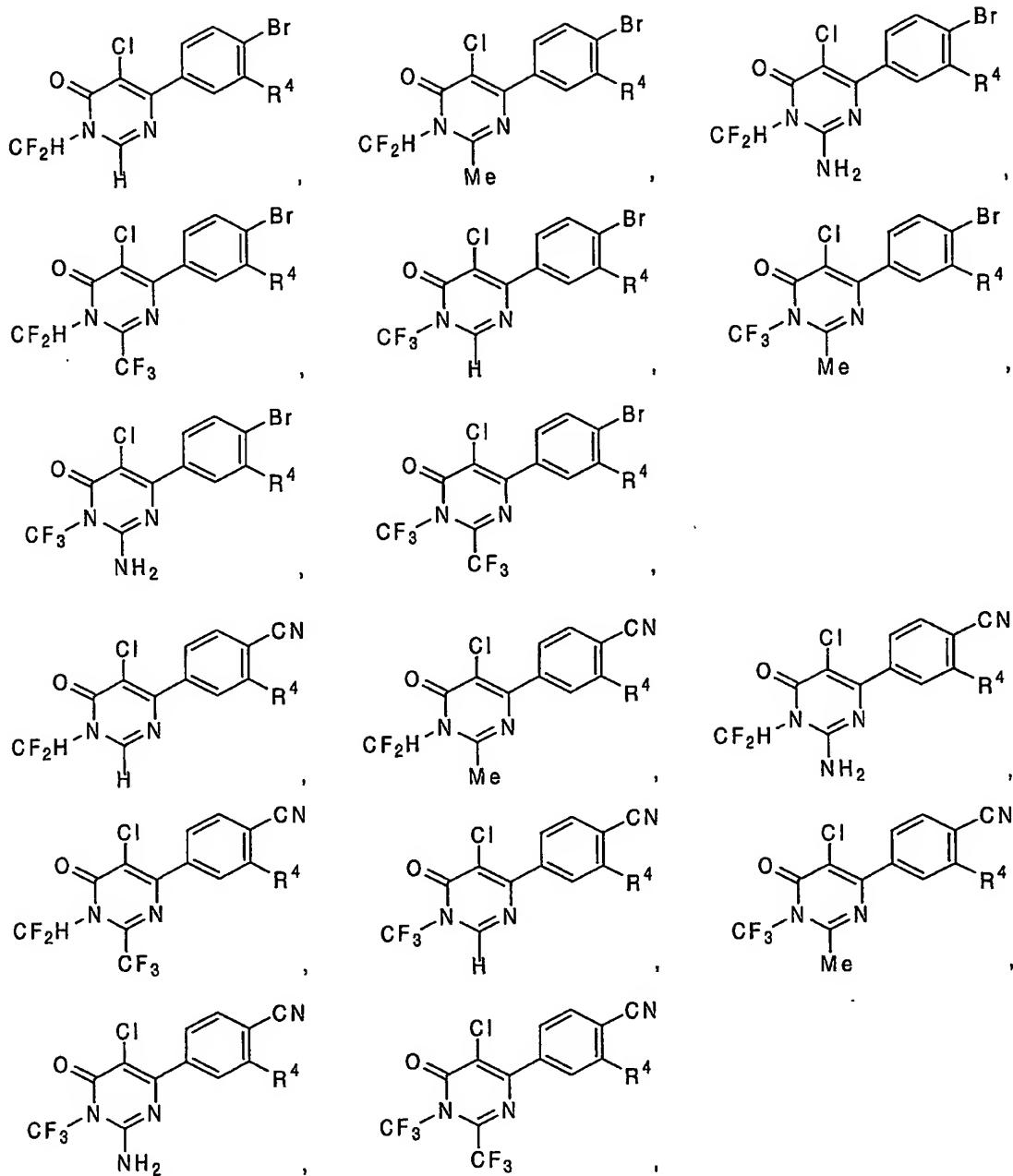


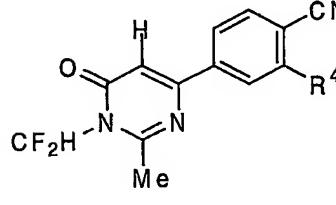
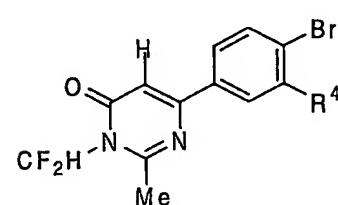
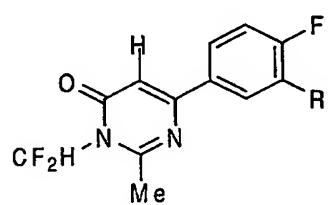
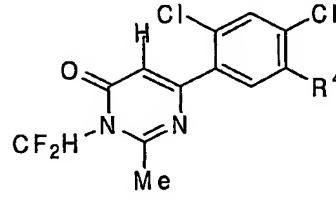
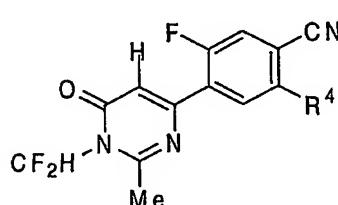
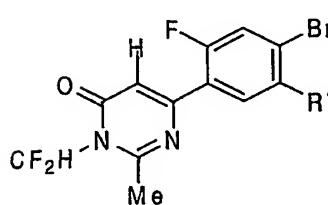
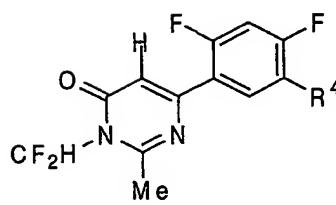
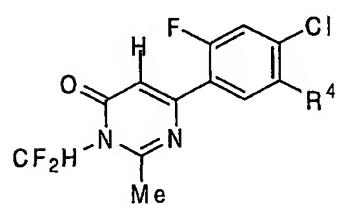
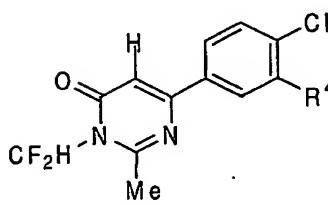
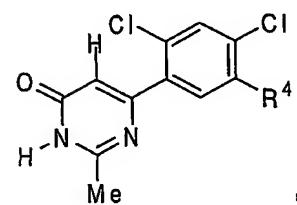
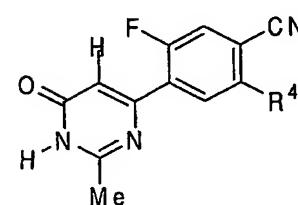
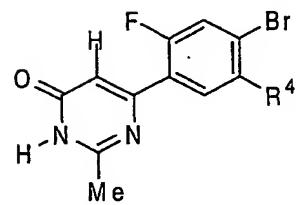
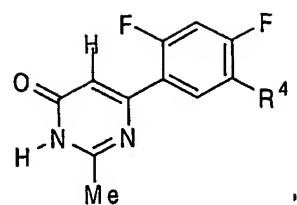
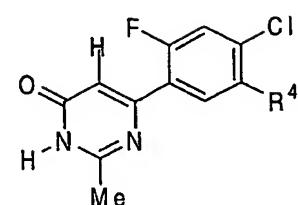


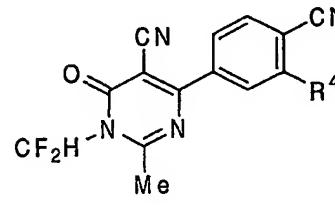
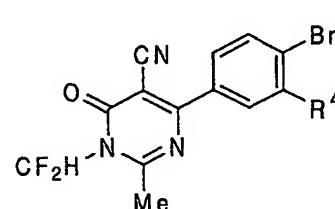
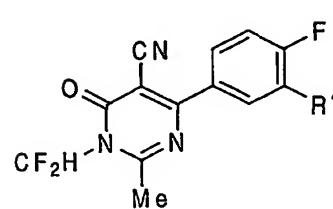
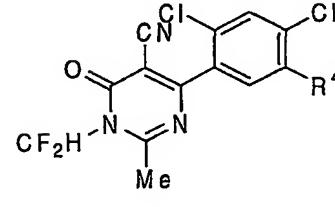
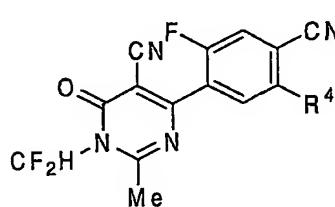
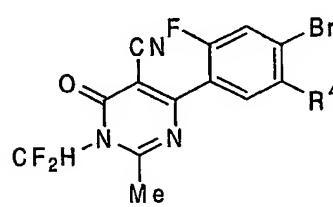
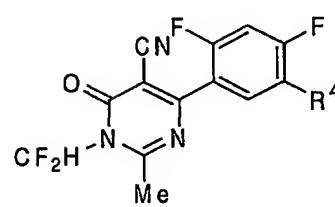
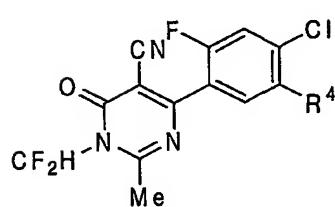
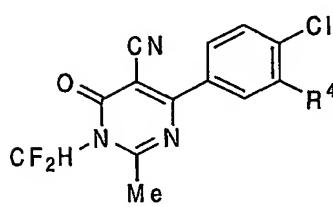
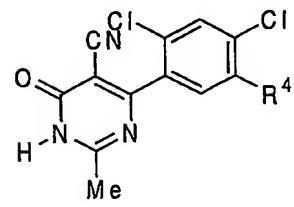
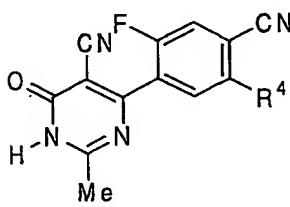
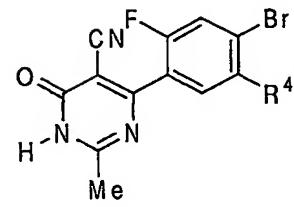
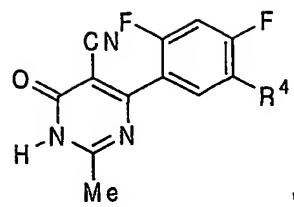
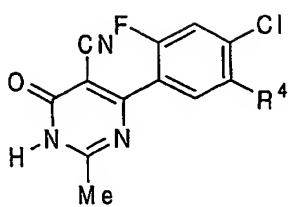


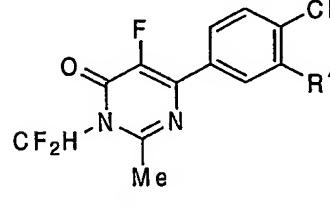
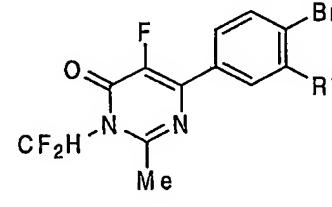
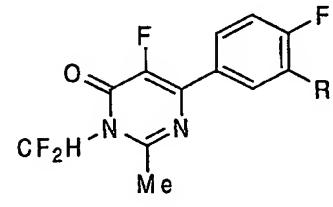
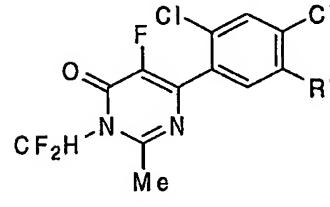
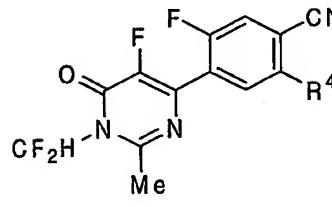
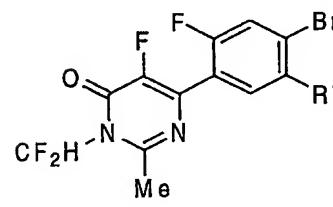
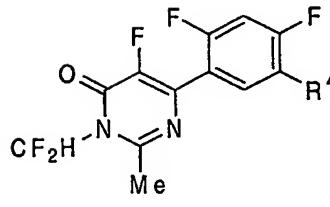
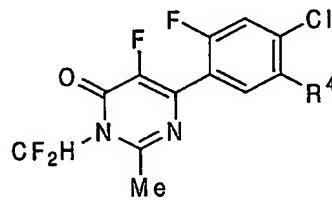
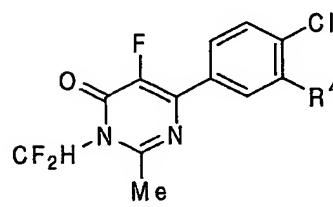
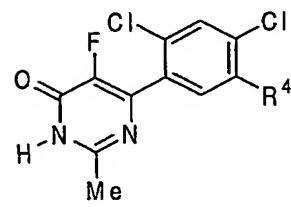
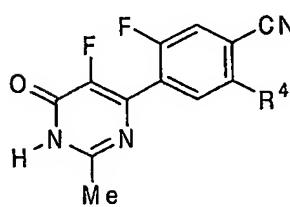
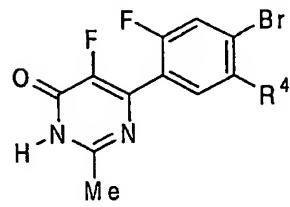
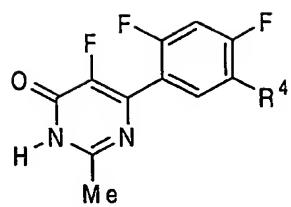
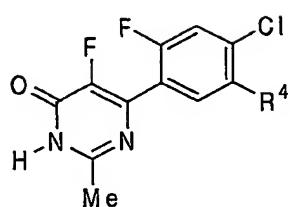


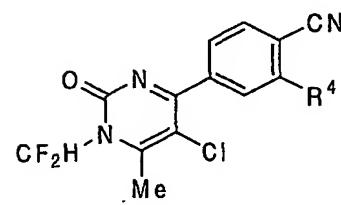
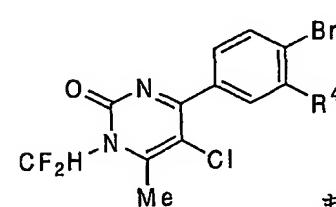
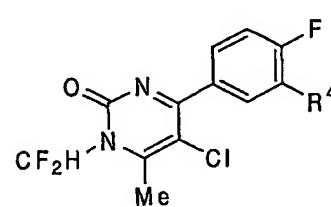
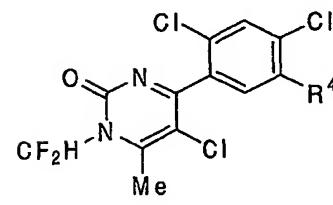
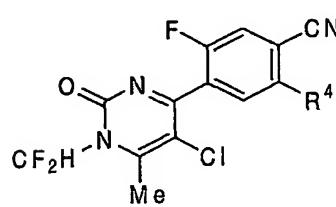
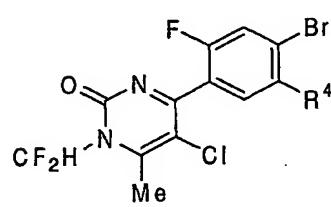
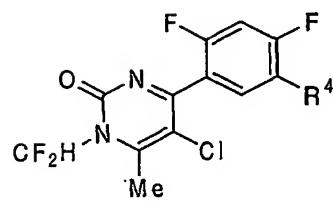
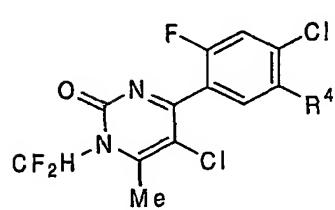
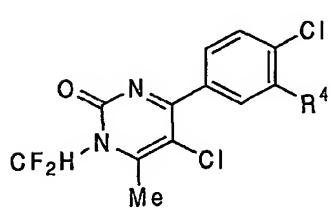
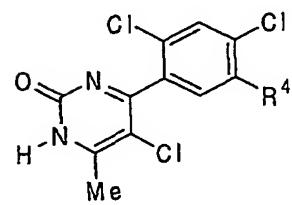
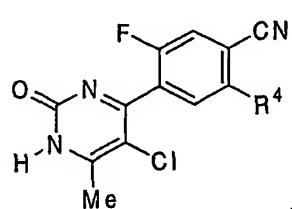
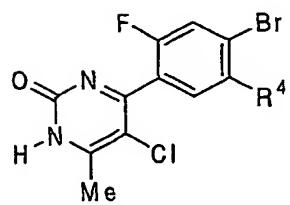
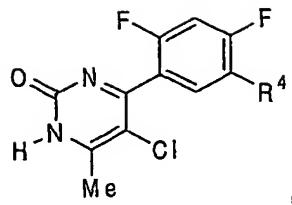
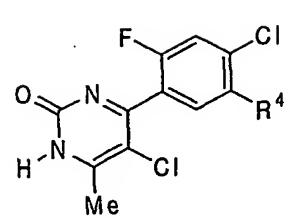












または

---

R<sup>4</sup>

---

H、F、Cl、Br、I、CHO、CO<sub>2</sub>H、C(O)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>Cl、C(O)Me、SH、OH、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、Ph、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、cyclo-Pr、cyclo-Bu、cyclo-Pen、cyclo-Hex、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH(Me)CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、CH(Me)C≡CH、OMe、OEt、O(iso-Pr)、OPr、OBu、O(sec-Bu)、O(tert-Bu)、O(iso-Bu)、O(cyclo-Pen)、O(cyclo-Pr)、O(cyclo-Hex)、O(neo-Pen)、O(tert-Pen)、Open、OHex、OHeP、OOct、OCH<sub>2</sub>Ph、OPh、O(4-Cl-Ph)、O(3-Me-Ph)、O(2-Me-Ph)、O(4-MeO-Ph)、O(3-MeO-Ph)、O(2-MeO-Ph)、OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH=CHMe、OCHMeCH=CH<sub>2</sub>、OCMe<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C≡CH、OCHMeC≡CH、OCMe<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>CH=CClH、OCH<sub>2</sub>Cl=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>C≡CH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OPr、OCH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>Ph、OCH<sub>2</sub>O(cyclo-Pen)、OCH<sub>2</sub>O(cyclo-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(cyclo-Pr)、OCH<sub>2</sub>O(tert-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(iso-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(sec-Bu)、OCH<sub>2</sub>O(OPr)、OCH<sub>2</sub>O(iso-Pr)、OCH<sub>2</sub>OBu、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>、OCH(Me)OMe、O-(テトラヒドロピラン-2-イル)、O-(テトラヒドロピラン-3-イル)、O-(テトラヒドロピラン-4-イル)、O-(テトラヒドロフラン-2-イル)、O-(テトラヒドロフラン-3-イル)、O-オキシラニル、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Bu)、OCH<sub>2</sub>

(cyclo-Pen)、OCH<sub>2</sub>(cyclo-Hex)、OCH<sub>2</sub>(1, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)、O-(2, 3-エポキシプロピル)、OCH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>(テトラヒドロフラン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサンラン-4-イル)、OCH(CH<sub>2</sub>OEt)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>(テトラヒドロピラン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(フラン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(フラン-3-イル)、OCH<sub>2</sub>(テトラヒドロフラン-3-イル)、OCH<sub>2</sub>(3-メチルオキセタン-3-イル)、OCHMe(cyclo-Pr)、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C≡CMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OOC(O)Me、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(モルホリン-1-イル)、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(ピロリジン-1-イル)、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(2-ピロリドン-1-イル)、O-(2-シクロヘキセン-1-イル)、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OPh、OCHEtC≡CH、OCHPrC≡CH、OCH(iso-Bu)C≡CH、OCHPhC≡CH、OCHBuC≡CH、OCH(iso-Pr)C≡CH、OCH(CHMePr)C≡CH、OCH<sub>2</sub>C≡CPH、OCH<sub>2</sub>C≡CCH<sub>2</sub>OMe、OCHMeC≡CEt、OCH<sub>2</sub>CH=C(Me)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CHMeCH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>C≡CH、OCHEtCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>OEt、OCHMeCH<sub>2</sub>OPr、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CHMe、OCH(CH<sub>2</sub>Cl)CH<sub>2</sub>O(iso-Pr)、OCH(CH<sub>2</sub>Cl)CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CHCl、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CHCl、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCHBrCH<sub>2</sub>OEt、OCH(CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、OCH(CH<sub>2</sub>Cl)CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CHCl、OCH(CH<sub>2</sub>F)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMeOPh、OCHMeCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>OMes、OCHMeCH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>

H<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、OCHEtCH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、OCHMeCH<sub>2</sub>OPh、OCHMeCH=CH<sub>2</sub>、OCHMeCH=CHMe、OCH(CH=CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CHC1CH<sub>2</sub>C1、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br、OCH(CH<sub>2</sub>C1)<sub>2</sub>、OCH(CH<sub>2</sub>Br)<sub>2</sub>、OCHMeCH<sub>2</sub>Cl、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、OCH(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CN、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、OCHPhCO<sub>2</sub>Me、OCHPhCO<sub>2</sub>Et、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NMe<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)Me、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me、OCH<sub>2</sub>C(O)Me、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(オキシラニル)、O-(ピリミジン-2-イル)、O-(4-ブタノリド-2-イル)、O-(2, 3-エポキシプロピル)、OCH<sub>2</sub>CN、OCHMeCN、OC(O)Me、OC(O)Et、OC(O)Pr、OC(O)(iso-Pr)、OC(O)CH=CMes、OC(O)CH<sub>2</sub>Cl、OC(O)CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、OC(O)(モルホリン-1-イル)、OC(O)CH<sub>2</sub>OMe、OCO<sub>2</sub>Me、OCO<sub>2</sub>Et、OCO<sub>2</sub>Pr、OCO<sub>2</sub>iso-Pr、OCO<sub>2</sub>Ph、OC(O)NH<sub>2</sub>、OC(O)NEt<sub>2</sub>、OC(O)NPr<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、O(iso-Pen)、SMe、SET、S(iso-Pr)、SPr、SBu、S(sec-Bu)、S(iso-Bu)、S(cyclo-Pen)、S(cyclo-Pr)、S(cyclo-Hex)、S(neo-Pen)、S(tert-Pen)、SPen、SHex、SHep、SOct、SCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、SCHMeCH=CH<sub>2</sub>、SCMe<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、SCH<sub>2</sub>C≡CH、SCHMeC≡CH、SCMe<sub>2</sub>C≡CH、SCH<sub>2</sub>CH=CC1H、SCH<sub>2</sub>CC1=CH<sub>2</sub>、SCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、SCH<sub>2</sub>OMe、SCH<sub>2</sub>OEt、SCH<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、SCH<sub>2</sub>CN、NHMe、NHEt、NH(iso-Pr)、NHPr、NHBu、NH(sec-Bu)、NH(iso-Bu)、NH(cyclo-Pen)、NH(cyclo-Pr)、NH(cyclo-Hex)、NH(neo-Pen)、NH(tert-Pen)、NHPen、NHHex、NHHep、NHOct、NHCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、NHCHMeCH=CH<sub>2</sub>、NHCMesCH=CH<sub>2</sub>、NHCH<sub>2</sub>C≡

CH、NHCHMeC≡CH、NHCM<sub>2</sub>C≡CH、NHCH<sub>2</sub>CH=CC<sub>1</sub>H  
 、NHCH<sub>2</sub>CC<sub>1</sub>=CH<sub>2</sub>、NHCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、NHCH  
 2CH<sub>2</sub>OEt、NHCH<sub>2</sub>OMe、NHCH<sub>2</sub>OEt、NHCH<sub>2</sub>(cyclo-  
 Pr)、NHCH<sub>2</sub>CN、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、CO  
 2Pr、CO<sub>2</sub>(cyclo-Pr)、CO<sub>2</sub>Bu、CO<sub>2</sub>(sec-Bu)、CO  
 2(iso-Bu)、CO<sub>2</sub>(tert-Bu)、CO<sub>2</sub>(cyclo-Bu)、  
 CO<sub>2</sub>Pen、CO<sub>2</sub>(cyclo-Pen)、CO<sub>2</sub>Pen、CO<sub>2</sub>(neo-P  
 en)、CO<sub>2</sub>(tert-Pen)、CO<sub>2</sub>Hex、CO<sub>2</sub>(cyclo-He  
 x)、CO<sub>2</sub>Hep、CO<sub>2</sub>Oct、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CHMeCH  
 =CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CMe<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、CO<sub>2</sub>CHMeC≡  
 CH、CO<sub>2</sub>CMe<sub>2</sub>C≡CH、CO<sub>2</sub>CMe<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CM  
 e<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CHMeCH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CMe<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CM<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>  
 CM<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、CO<sub>2</sub>CMe<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C≡CH、CO<sub>2</sub>CM  
 e<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CMe<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>  
 CH<sub>2</sub>OMe、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、CONMe<sub>2</sub>、CONEt<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>  
 Me、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pr、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>Me、  
 CH<sub>2</sub>CMeC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>CMeC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>E  
 t、CH<sub>2</sub>CHBrCO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>SO<sub>2</sub>Ph、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>SO<sub>2</sub>M  
 e、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(O)Me、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>  
 (iso-Pr)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>(cyclo-Hex)、CH<sub>2</sub>CHC  
 1CO<sub>2</sub>(tert-Bu)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>(iso-Bu)、CH<sub>2</sub>CH  
 C<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>Bu、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>(sec-Bu)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>P  
 r、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(テトラヒドロフラン-2-イル)、CH<sub>2</sub>CHC  
 1C(O)(モルホリン-1-イル)、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C  
 MeC<sub>1</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CMeC<sub>1</sub>C(O)NMe<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO  
 2CH(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C  
 H<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>CONHOMe、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(O)NHMe、  
 CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(O)NHEt、CH<sub>2</sub>CHC<sub>1</sub>C(O)NH(iso-Pr)

、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH(iso-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH(sec-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH(tert-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH(cyclo-Hex)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHCH(iso-Pr)CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHNMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH}$ (モルホリン-1-イル)、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHPH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH}$ (チアゾール-2-イル)、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NH}$ (5-メチルイソオキサゾール-3-イル)、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHBrC}(\text{O})\text{NMMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMeBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMe(iso-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMeOMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NEt}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NETPr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NET(iso-Pr)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NETBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NET(tert-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(iso-Pr)}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NPr(sec-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(CH}_2\text{CH=CH}_2)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(CH}_2\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(iso-Pr)(cyclo-Hex)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(CH}_2\text{CH=CH}_2)$ (cyclo-Hex)、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(CH}_2\text{CH=CH}_2)$ (cyclo-Pen)、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMePh}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMe}$ (ピリジン-2-イル)、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(ピロリジン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(チオモルホリン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(4-メチルピペラジン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{N(cyclo-Hex)Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMeCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMeOCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMeOCH}_2\text{CMe} (= \text{NOMe})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{NMMeOCH}_2\text{CH=CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{CO}_2\text{CHMeCH=CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{CO}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2$ (cyclo-

1 o - P r ) 、 C H<sub>2</sub>CHC 1 CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHC 1 CH<sub>2</sub>C l 、 C H<sub>2</sub>CHC 1 C  
 O<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH = C M e C l 、 C H<sub>2</sub>CHC 1 CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S M e 、 C H<sub>2</sub>CH  
 C 1 CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E t 、 C H<sub>2</sub>CHC 1 C N 、 C H<sub>2</sub>CC 1<sub>2</sub>C N 、 C H<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>  
 CO<sub>2</sub>M e 、 C H<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C (O) N M e<sub>2</sub> 、 C H<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>M e 、 C H<sub>2</sub>C  
 O<sub>2</sub>M e 、 C H<sub>2</sub>CHM e CO<sub>2</sub>M e 、 C H<sub>2</sub>(2-クロロブタノリド-2-イル)  
 、 C H = C HCO<sub>2</sub>M e 、 C H = C HCO<sub>2</sub>E t 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>M e 、 O C H<sub>2</sub>C  
 O<sub>2</sub>E t 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>P r 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>B u 、 C  
 HFCO<sub>2</sub>M e 、 O CHFCO<sub>2</sub>E t 、 O CHFCO<sub>2</sub>P r 、 O CHFCO<sub>2</sub>B u 、  
 O CHFCO<sub>2</sub>Ph 、 C H C 1 CO<sub>2</sub>M e 、 O CHC 1 CO<sub>2</sub>E t 、 O CHC 1 C  
 O<sub>2</sub>P r 、 O C C 1 F CO<sub>2</sub>B u 、 C H B r CO<sub>2</sub>M e 、 O C H B r CO<sub>2</sub>E t 、 O  
 C H B r CO<sub>2</sub>P r 、 O C H B r CO<sub>2</sub>B u 、 O C F<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>M e 、 O C F<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E  
 t 、 O C F<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>P r 、 O C F<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>B u 、 O C C 1<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>M e 、 O C C 1<sub>2</sub>C  
 O<sub>2</sub>P en 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(tert-B u) 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Ph 、 O C H<sub>2</sub>CO  
 O<sub>2</sub>P en 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H e x 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(cyclo-P en) 、 O C H<sub>2</sub>  
 CO<sub>2</sub>(iso-P r) 、 O C H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph 、 O C H M e CO<sub>2</sub>M e 、 O C  
 H M e CO<sub>2</sub>E t 、 O C H M e CO<sub>2</sub>P r 、 O C H M e CO<sub>2</sub>(iso-P r) 、  
 O C H M e CO<sub>2</sub>P en 、 O C H M e CO<sub>2</sub>(cyclo-P en) 、 O -(4-  
 ブタノリド-2-イル) 、 O -(5-ペンタノリド-2-イル) 、 O -(6-ヘ  
 キサノリド-2-イル) 、 O C H (CO<sub>2</sub>M e)<sub>2</sub> 、 O C H (CO<sub>2</sub>E t)<sub>2</sub> 、 O C  
 H (CO<sub>2</sub>P r)<sub>2</sub> 、 O C H (CN) CO<sub>2</sub>M e 、 O C H (CN) CO<sub>2</sub>E t 、 O C  
 M e<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>M e 、 O C M e<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E t 、 O C M e<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH = C H<sub>2</sub> 、 O C  
 M e<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C ≡ C H 、 O C H M e CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH = C H<sub>2</sub> 、 O C H M e C O  
 2CH<sub>2</sub>C ≡ C H 、 O C H<sub>2</sub>C (O) N M e<sub>2</sub> 、 O C H<sub>2</sub>C (O) N M e (C H<sub>2</sub>C ≡ C H)  
 、 O C H<sub>2</sub>C (O) N M e (C H<sub>2</sub>CH = C H<sub>2</sub>) 、 O C H<sub>2</sub>C (O) N H M e 、 O  
 C H<sub>2</sub>C (O) (ピロリジン-1-イル) 、 O C H<sub>2</sub>C (O) (ピペリジン-1-  
 イル) 、 O C H<sub>2</sub>C (O) M e 、 O C H<sub>2</sub>C (O) E t 、 O C H<sub>2</sub>C (O) P r 、  
 O C H<sub>2</sub>C (O) C H<sub>2</sub>OM e 、 O C H<sub>2</sub>C (O) (4-C I -P h) 、 O C H<sub>2</sub>C  
 (O) (4-B r -P h) 、 O C H<sub>2</sub>C (O) (3-C I -P h) 、 O C H<sub>2</sub>C (



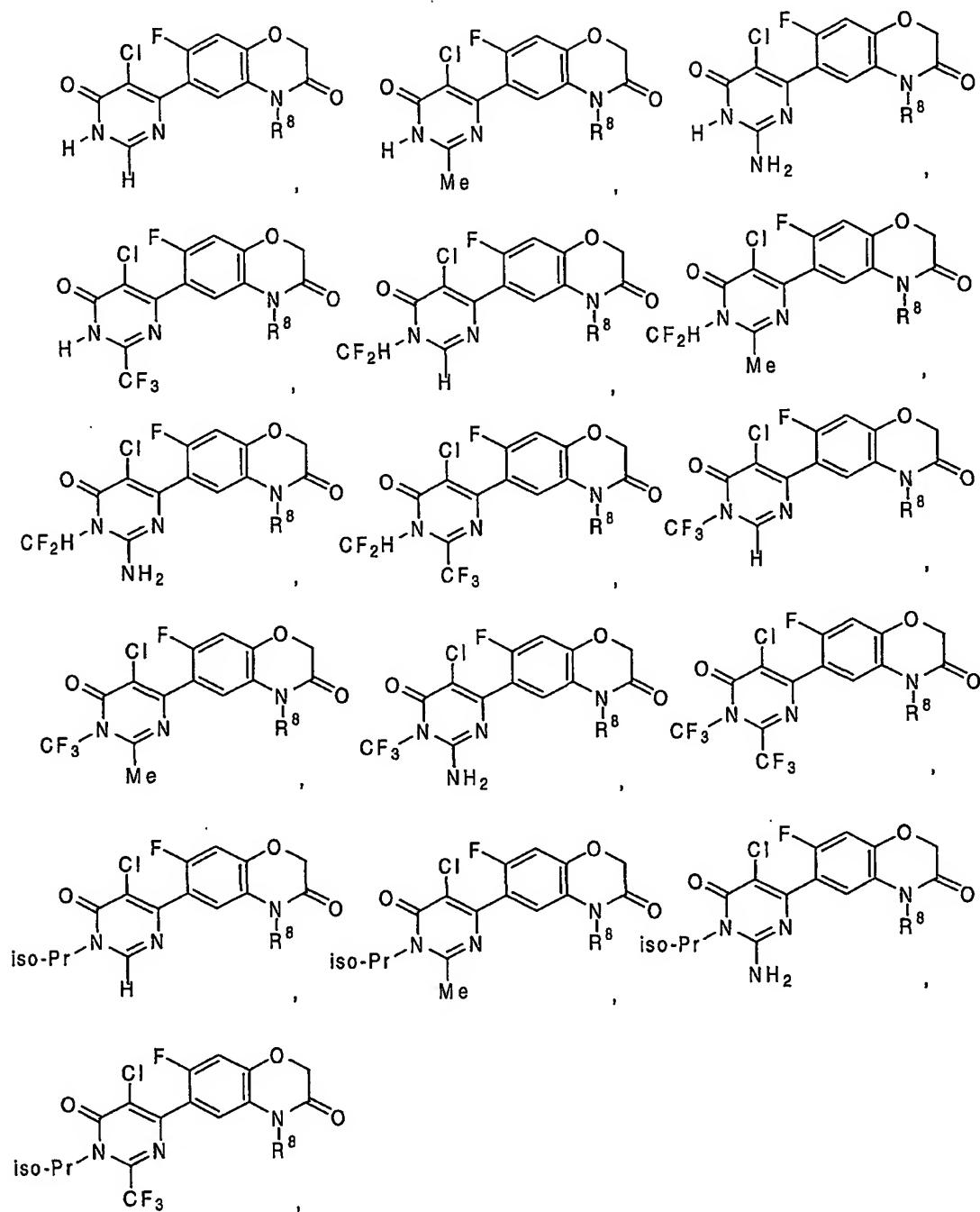
O<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (4-CF<sub>3</sub>-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (2-F-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (3-F-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (3-Cl-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (2-Cl-Ph)、NHCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (4-CF<sub>3</sub>O-Ph)、NHSO<sub>2</sub>Me、NHSO<sub>2</sub>Et、NHSO<sub>2</sub>Pr、NHSO<sub>2</sub>(iso-Pr)、NHSO<sub>2</sub>Bu、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph、NHSO<sub>2</sub>CHCl<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>Ph、N(SO<sub>2</sub>Et)CO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>OMe)SO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>C=CH)SO<sub>2</sub>Et、NMeSO<sub>2</sub>Me、N(SO<sub>2</sub>Me)<sub>2</sub>、N(SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl)<sub>2</sub>、N(SO<sub>2</sub>Et)<sub>2</sub>、N(SO<sub>2</sub>Pr)<sub>2</sub>、NEtSO<sub>2</sub>Et、NMeSO<sub>2</sub>Et、NETSO<sub>2</sub>Et、N(Pr)SO<sub>2</sub>Et、N(C(O)Me)SO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>OMe)SO<sub>2</sub>Me、N(CH<sub>2</sub>OEt)SO<sub>2</sub>Me、N(CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>)SO<sub>2</sub>Me、N(CH<sub>2</sub>C≡CH)SO<sub>2</sub>Me、CONHSO<sub>2</sub>Me、CONHSO<sub>2</sub>Et、CONHSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、1,3-ジオキソラン-2-イル、1,3-ジオキサン-2-イル、4-(EtOC(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-PhO、4-(MeOC(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)-PhO、NMeCO<sub>2</sub>Me、N(CH<sub>2</sub>C≡CH)CO<sub>2</sub>Me、NMeC(O)Me、NHCHO、NHCO(O)CF<sub>3</sub>、NHCO(O)Et、NHCO(O)Me、NHCO(O)Pr、N(CH<sub>2</sub>C≡CH)COMe、N(CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>)CO<sub>2</sub>Me、NMeCO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> (4-Me-Ph)、N(CH<sub>2</sub>C≡CH)CO<sub>2</sub>Et、N(CH<sub>2</sub>CN)CO<sub>2</sub>Me、N(C(O)(tert-Bu))SO<sub>2</sub>Me、N(C(O)(tert-Bu))SO<sub>2</sub>Et、N(C(O)(2-MeO-Ph))SO<sub>2</sub>Me、N(C(O)(3-MeO-Ph))SO<sub>2</sub>Me、N(C(O)(2-MeO-Ph))SO<sub>2</sub>Et、N(C(O)(4-MeO-Ph))SO<sub>2</sub>Et、N(C(O)(4-Me-Ph))SO<sub>2</sub>Me、N(C(O)(4-Me-Ph))SO<sub>2</sub>Et、N(C(O)(4-Cl-Ph))SO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(オキセタン-3-イル)、N(CHO)CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、N(CHO)CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、N(CHO)CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pen、N(CHO)CHMeCO<sub>2</sub>Me、N(CHO)CHMeC

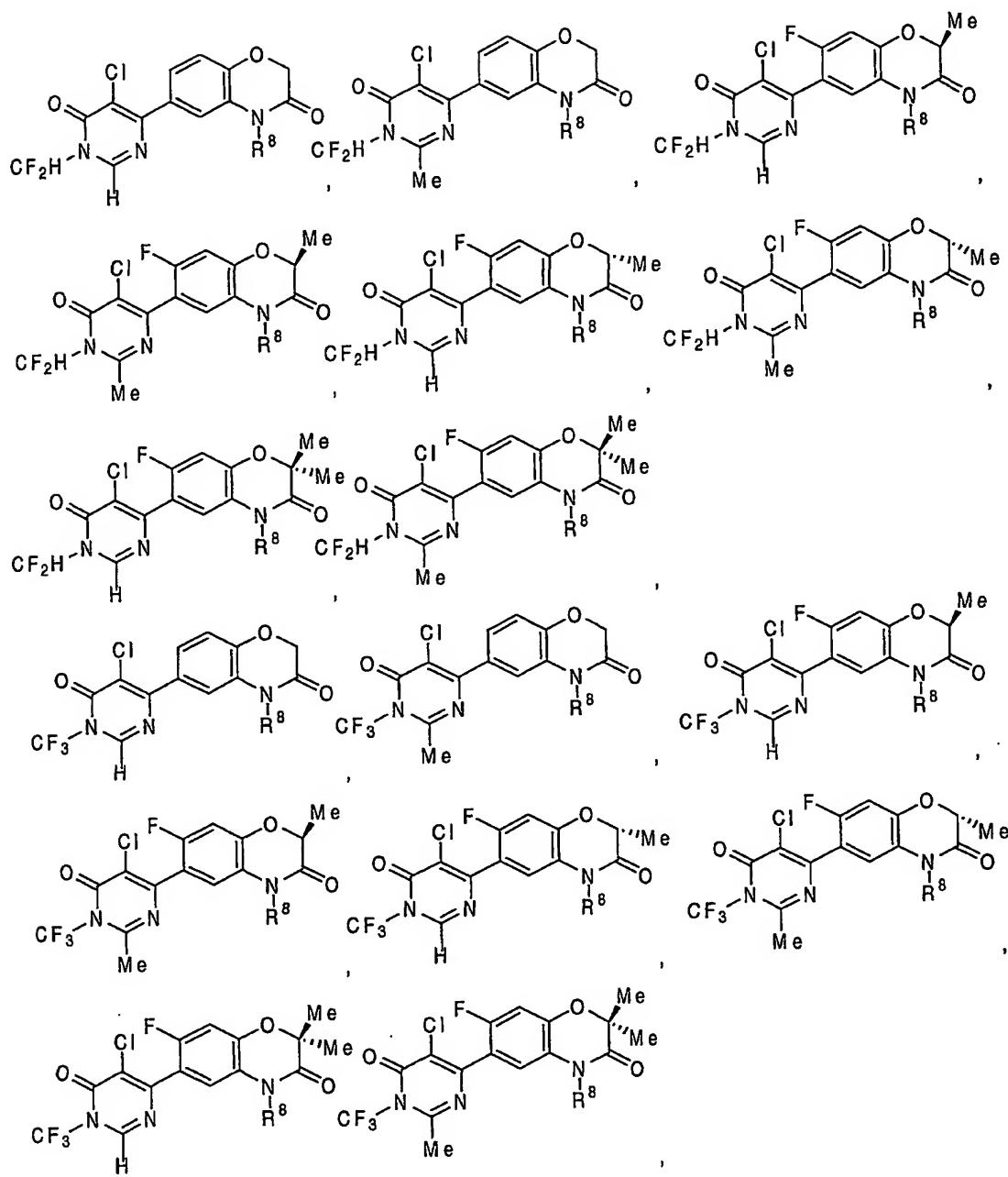
O<sub>2</sub>E t、N (C (O) Me) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、N (C (O) Me) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E t、N (C (O) Me) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Pen、N (C (O) Me) CHMeCO<sub>2</sub>Me、N (C (O) Me) CHMeCO<sub>2</sub>E t、N (CH<sub>2</sub>CN) SO<sub>2</sub>Me、N (SO<sub>2</sub>Me) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、N (SO<sub>2</sub>Me) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E t、N (SO<sub>2</sub>E t) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、N (SO<sub>2</sub>E t) CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E t、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>C l、CH<sub>2</sub>Br、CHBr<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OH、CHBrEt、CH<sub>2</sub>CHClCH<sub>2</sub>C l、CH(OH)CH=CH<sub>2</sub>、CH(OH)C≡CH、CH<sub>2</sub>CHClCO (O)Me、CH(CO<sub>2</sub>Me)<sub>2</sub>、CH(CO<sub>2</sub>E t)<sub>2</sub>、CH(CN)CO<sub>2</sub>Me、CH(CN)CO<sub>2</sub>E t、CH<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CN、CH=CHCN、CM<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>NMe<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>NEt<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>NPr<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>SMe、CH<sub>2</sub>SEt、CH<sub>2</sub>SPr、CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>C≡CH、CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>E t、CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>OPr、CH<sub>2</sub>O(iso-Pr)、CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>C≡CH、C(O)Et、C(O)Pr、C(O)(iso-Pr)、CH=N(OMe)、CH=N(OEt)、CH=N(OPr)、CH=N(OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>E t)、C(O)NHMe、C(O)NHEt、C(O)NHP<sub>r</sub>、CH=CClCO<sub>2</sub>Me、CH=CClCO<sub>2</sub>E t、CH<sub>2</sub>CHClP(O)(OMe)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CHClP(O)(OEt)<sub>2</sub>、NHC(O)CF<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>SMe、OCF<sub>3</sub>、OCF<sub>2</sub>H、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C l、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C l、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH(CN)CH<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CMe=CH<sub>2</sub>、OPh、O-(ピリジン-2-イル)、O-(ピリジン-4-イル)、O-(5-CF<sub>3</sub>-3-C1-ピリジン-2-イル)、O-(5-CF<sub>3</sub>-ピリジン-2-イル)、OCH<sub>2</sub>(4-Me-2-(MeOC(O)CHMeO)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-C1-2-(MeOC(O)CHMeO)-Ph)、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、2-ピリミジニルオキシ、2-ピリジルオキシ、4-ピリジルオキシ、5-クロロ-2-ピリジルオキシ、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、3-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、OCH<sub>2</sub>(4-(MeOCH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(MeOCH<sub>2</sub>O)-Ph)、OCH<sub>2</sub>(4-(EtOCH

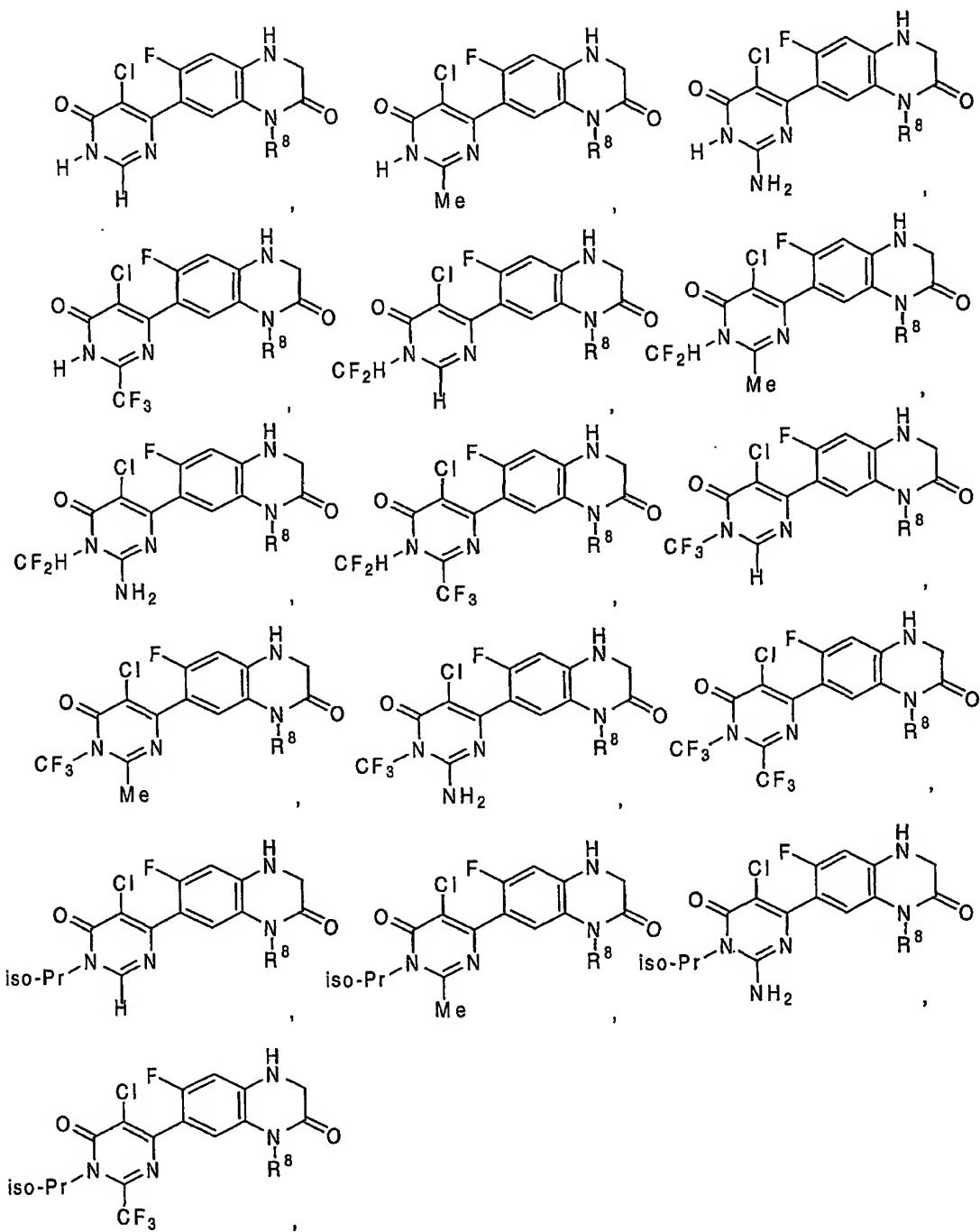
$\text{OC(O)CH}_2\text{CHMeO}-\text{Ph}$ )、 $\text{OCH}_2(4-(\text{MeOCH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{EtOCH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{EtOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{MeOCH}_2\text{CHMeOC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{FC}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{OC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{OC(O)CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OC(O)Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OC(O)Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OC(O)NNMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OSO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OP(O)(OEt)}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OC(O)Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{NMMe}_2$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{O}(i\text{so}-\text{Pr})$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OC(O)NNMe}_2$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OEt}$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{O}(i\text{so}-\text{Pr})$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OC(O)NMMe}_2$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{OP(O)(OEt)}_2$ 、 $\text{C}(\text{=NOCH}_2=\text{CHCH}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{C}(\text{=NOCH}_2\text{CH}_2\text{SMe}_3)\text{OMe}$ 、 $\text{C}(\text{=NO(テトラヒドロビラン-2-イル)})\text{OMe}$ 、 $\text{C}(\text{=NNMMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{C}(\text{=NSO}_2\text{Me})\text{OMe}$ 、 $\text{C}(\text{=NOMe})\text{NMMe}_2$ 、2-ピリジル、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル、フラン-2-イル、チオフェン-2-イル、5-クロロチオフェン-2-イル、4-メチル-1,3-オキサゾール-2-イル、 $\text{CH}(\text{CH}_2\text{Cl})\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH=CH}_2$ または $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{=NOMe})\text{OMe}$ (*i*so-Pr)

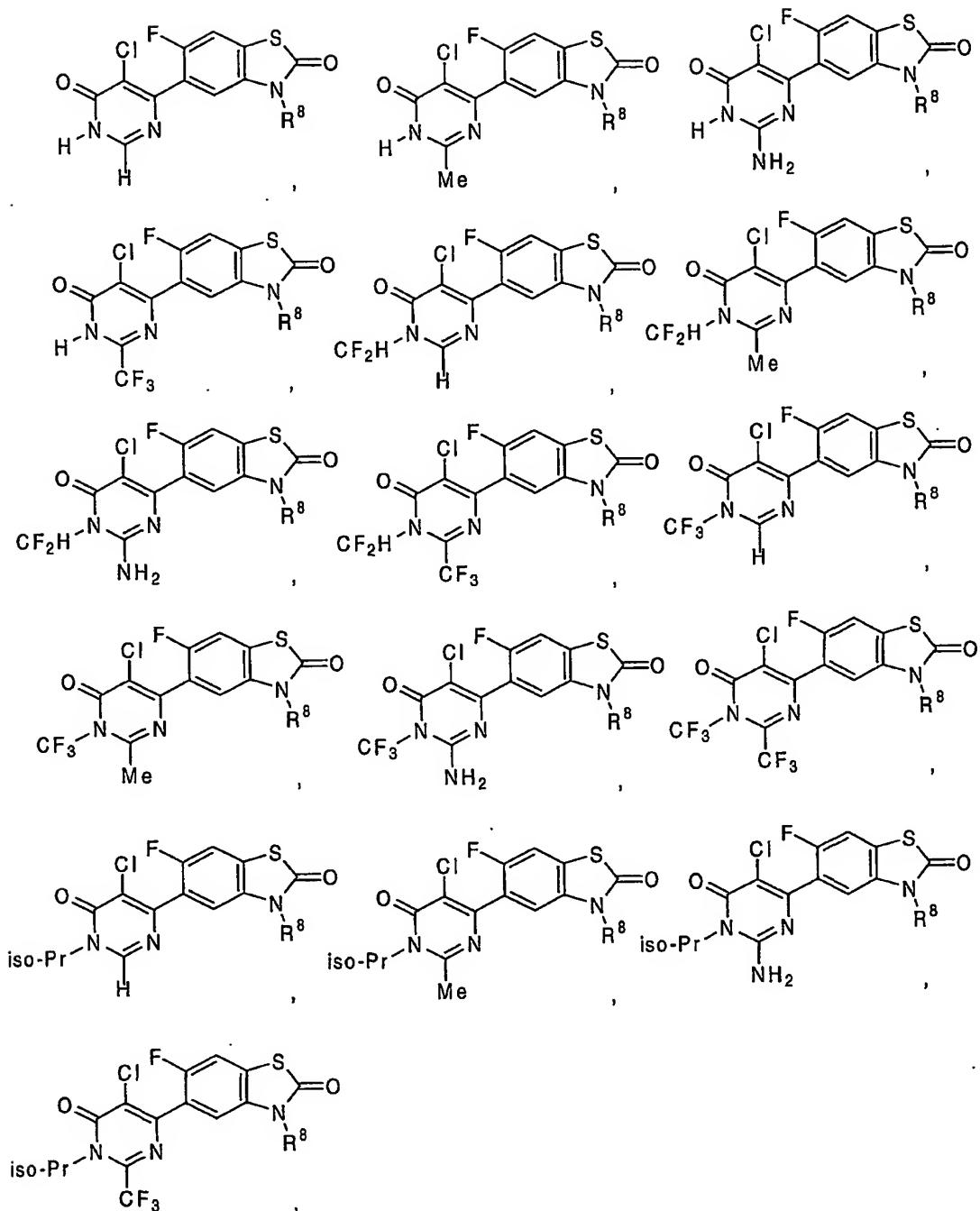
---

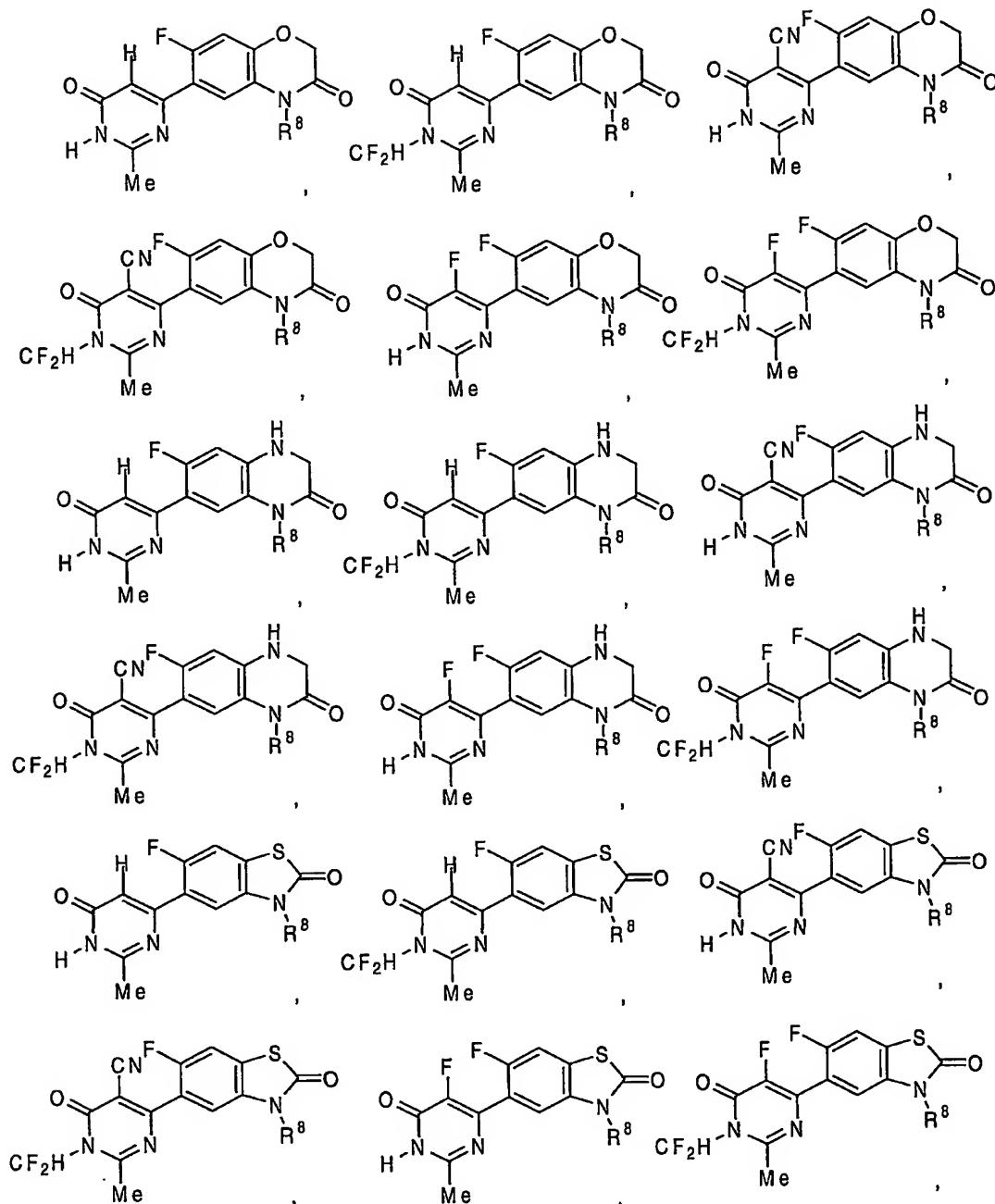
〔第5表〕

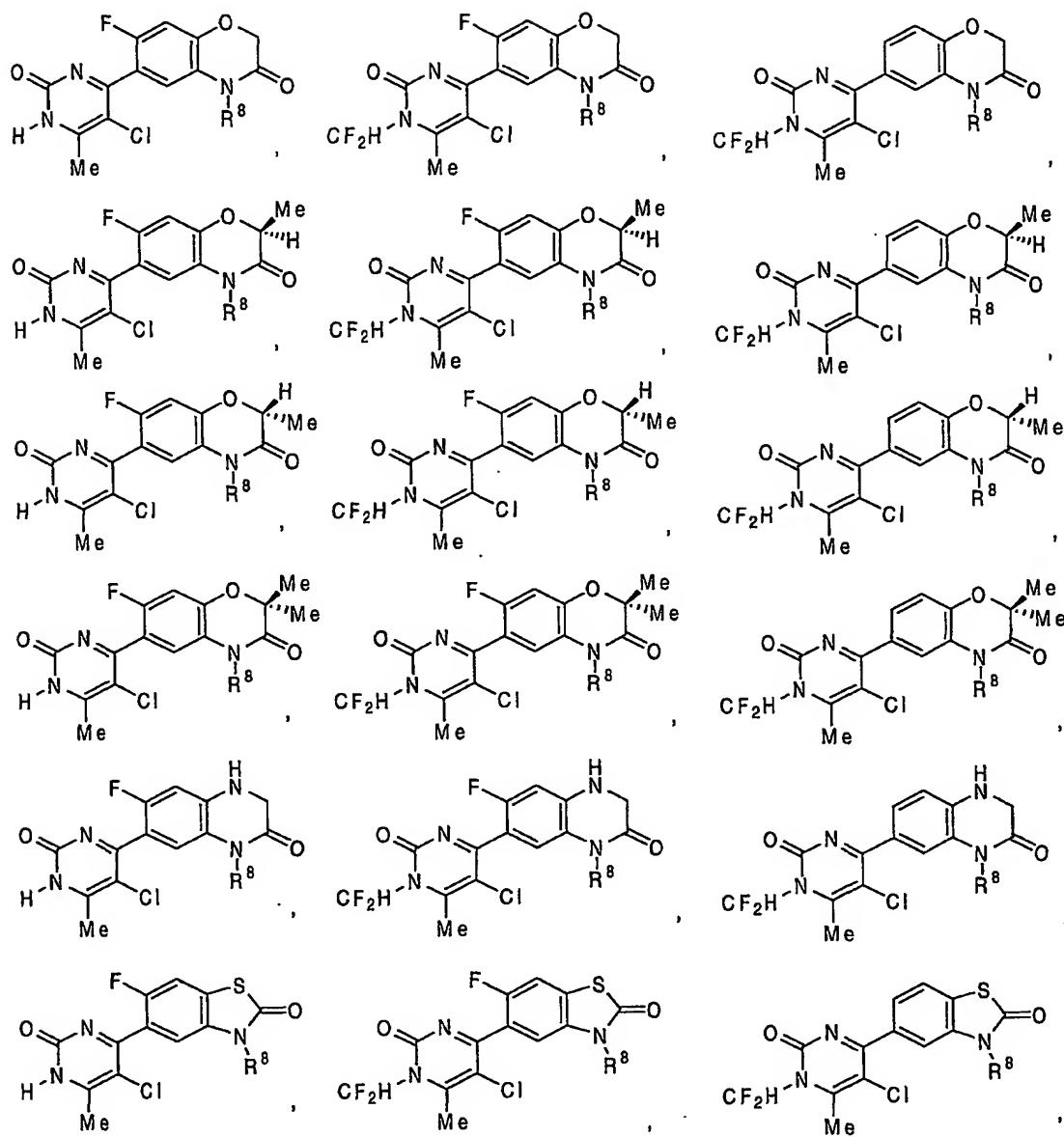


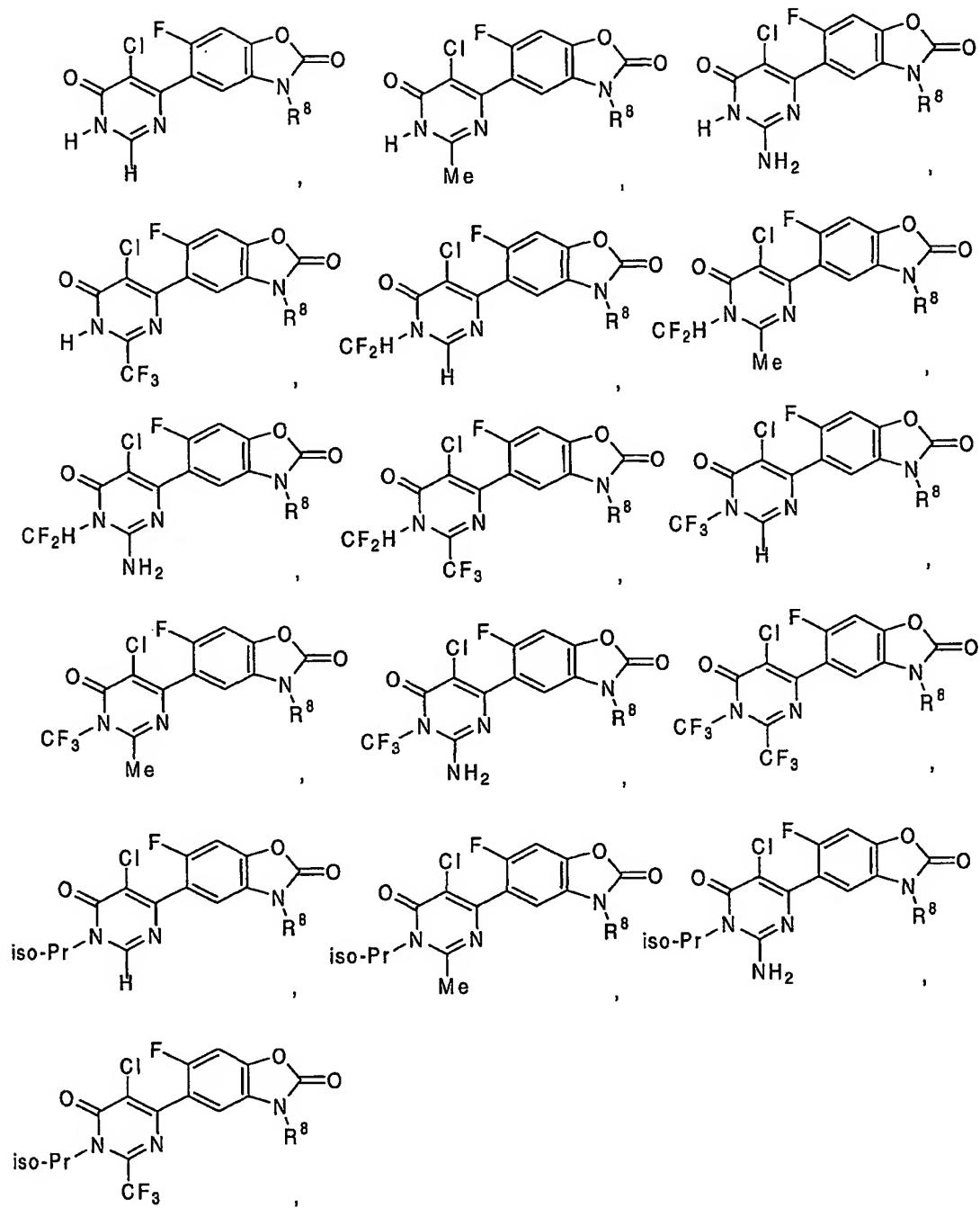


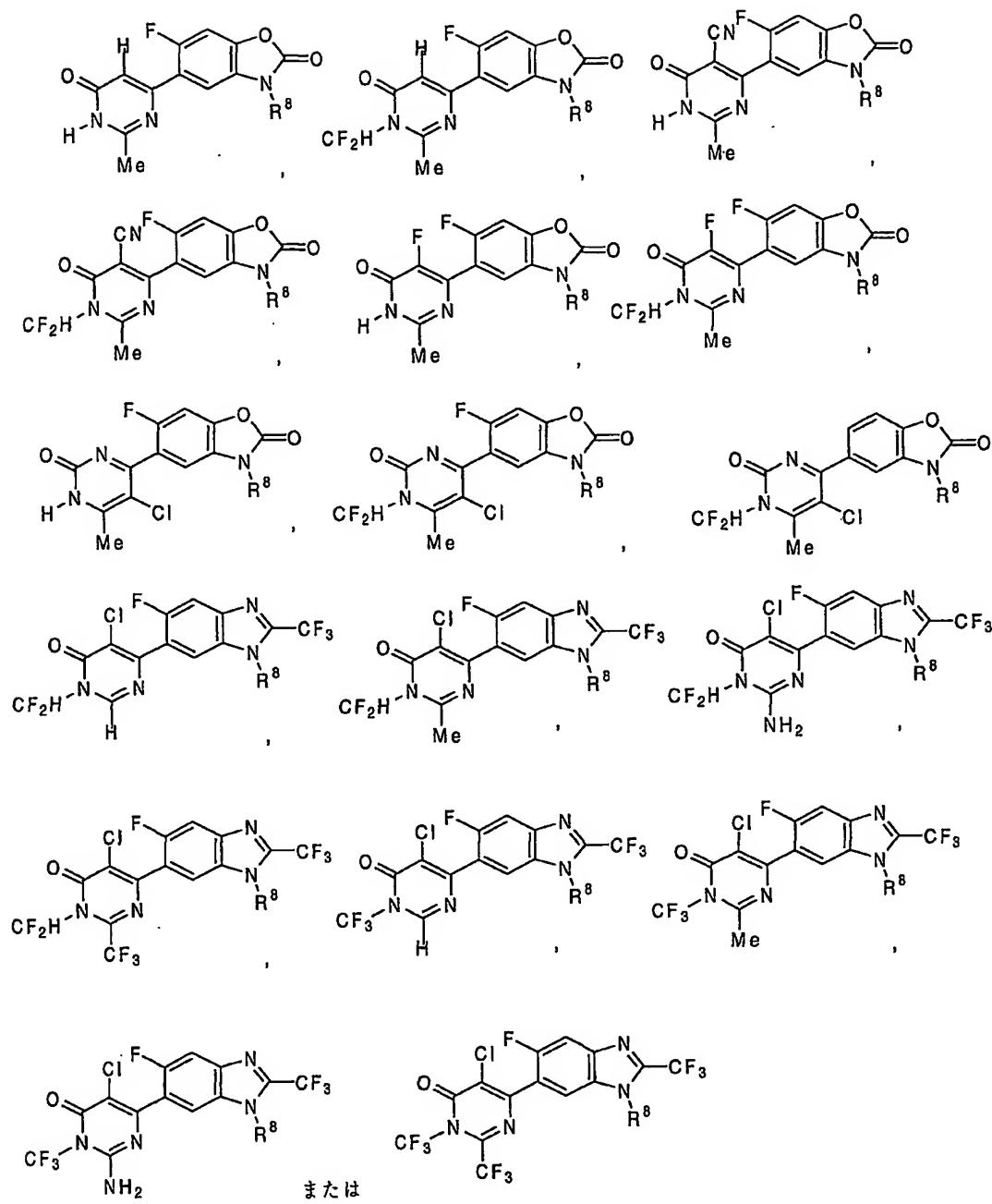












---

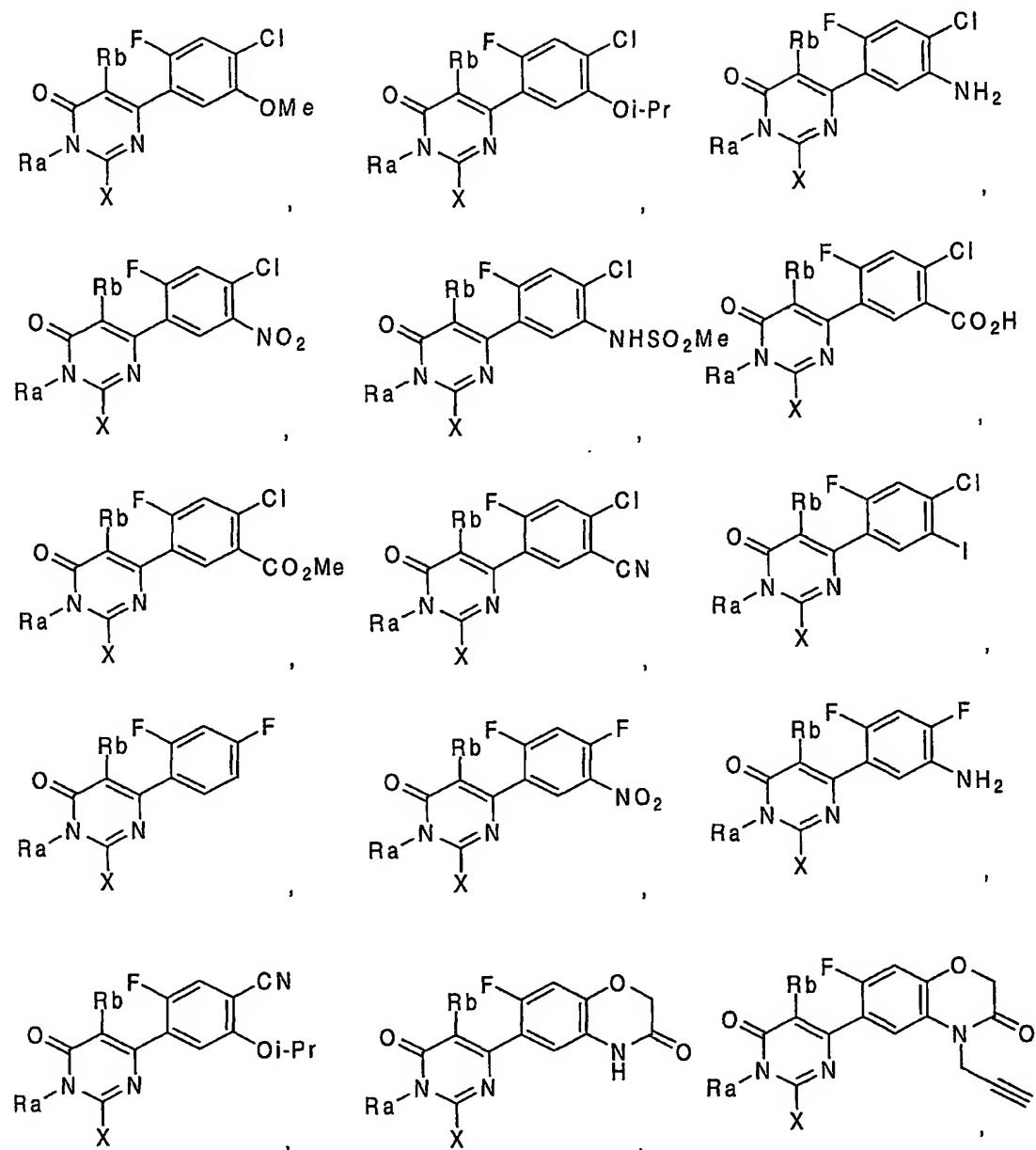
R<sup>8</sup>

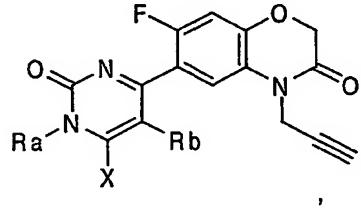
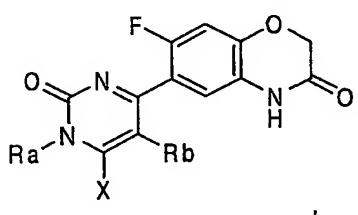
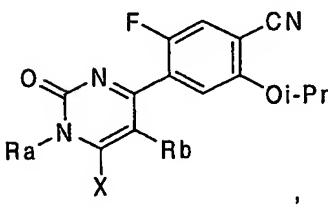
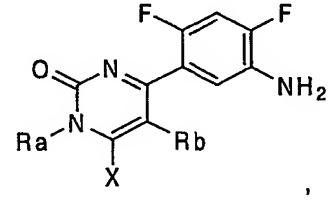
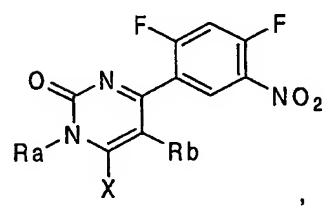
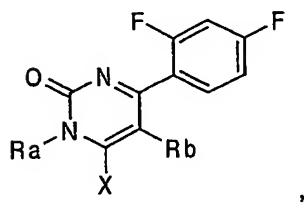
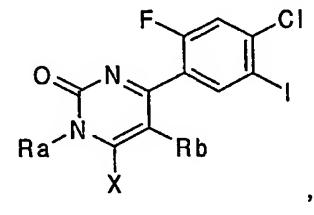
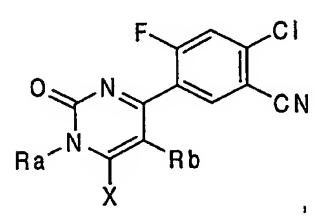
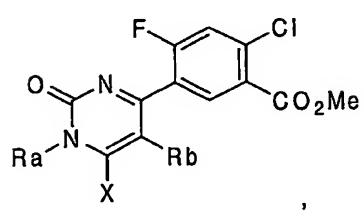
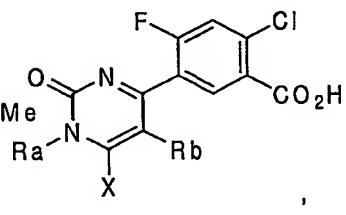
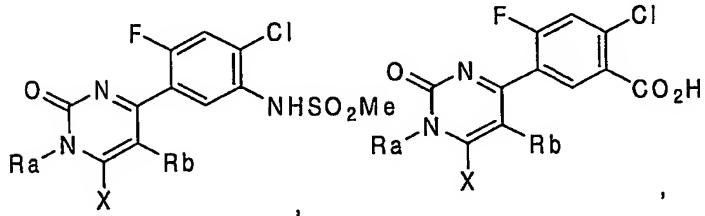
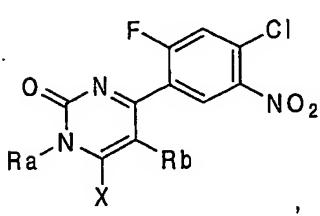
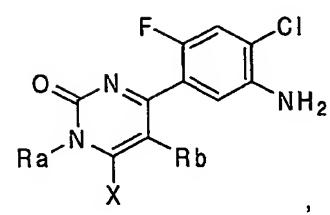
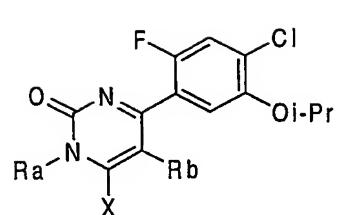
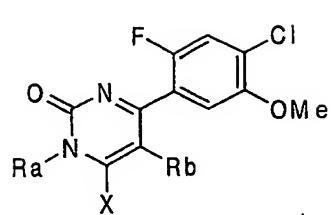
---

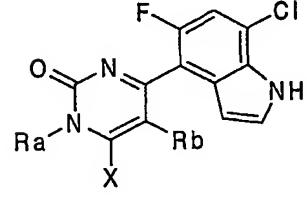
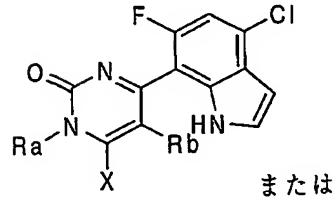
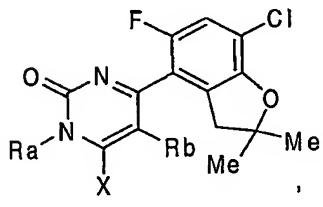
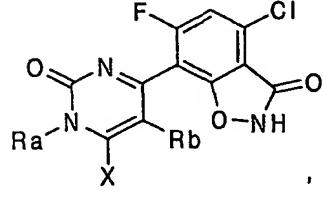
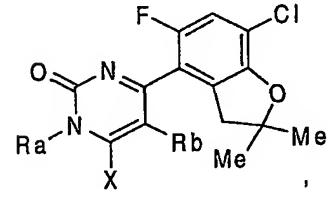
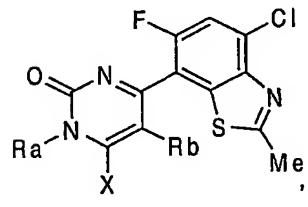
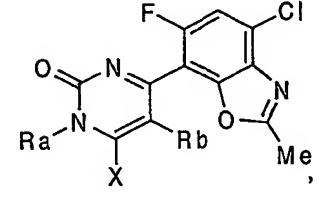
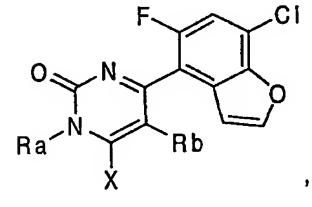
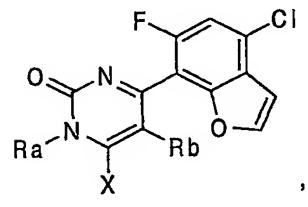
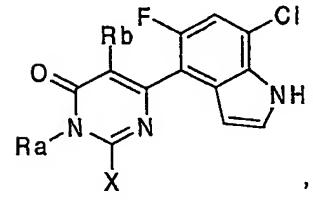
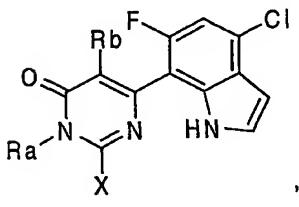
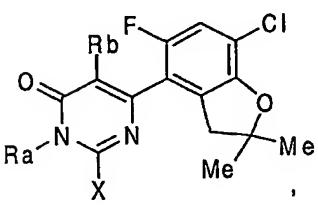
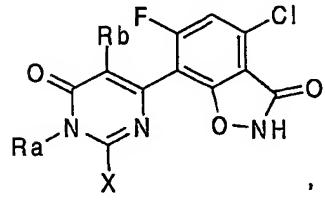
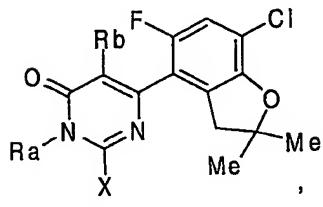
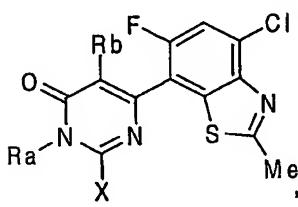
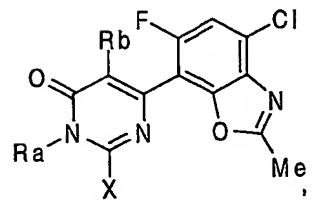
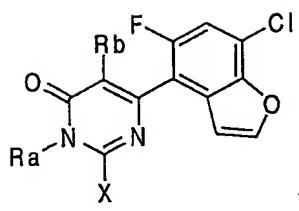
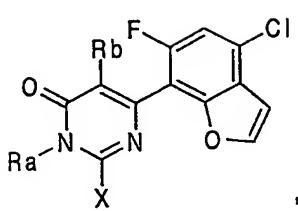
H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、C  
 H<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、CH<sub>2</sub>C≡N、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl  
 、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>Pr、CO<sub>2</sub>(tert-  
 Bu)、SO<sub>2</sub>Me、SO<sub>2</sub>Et、SO<sub>2</sub>Pr、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>  
 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>CCl=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CBBr  
 =CH<sub>2</sub>、CHMeC≡CH、CHMeC=CH<sub>2</sub>、OMe、OEt、OPr、C  
 H(Me)C≡N、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(iso-  
 Pr)、CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CONHMe、CH<sub>2</sub>CONMe<sub>2</sub>、CHMeCO<sub>2</sub>  
 Me、CHMeCO<sub>2</sub>Et、CHMeCO<sub>2</sub>(iso-Pr)、CHMeCONH  
<sub>2</sub>、CHMeCONHMe、CHMeCONMe<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C(=NOMe)OMe  
 、CH<sub>2</sub>C(=NOMe)OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>C(=NNMe<sub>2</sub>)OMe  
 、CHMeC(=NOMe)OMe、CHMeC(=NOMe)OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>M  
 e、CHMeC(=NNMe<sub>2</sub>)OMe、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et  
 、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、OCH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>CONHMe  
 、OCH<sub>2</sub>CONMe<sub>2</sub>、OCHMeCO<sub>2</sub>Me、OCHMeCO<sub>2</sub>Et、OCHMe  
 CO<sub>2</sub>(iso-Pr)、OCHMeCONH<sub>2</sub>、OCHMeCONHMe、OC  
 HM<sub>e</sub>CONMe<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C(=NOMe)OMe、OCH<sub>2</sub>C(=NOMe)  
 OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCH<sub>2</sub>C(=NNMe<sub>2</sub>)OMe、OCHMeC(=NO  
 Me)OMe、OCHMeC(=NOMe)OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、OCHMeC(=NNMe<sub>2</sub>)OMe  
 、OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>C≡N  
 、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、OCHMeCH=CH<sub>2</sub>  
 、OCHMeC≡CHまたはOCHMeC≡N

---

〔第6表〕







R b	R a	X
H	H	H
H	H	NH <sub>2</sub>
H	H	Et
H	H	iso-Pr
H	H	CF <sub>3</sub>
H	H	OMe
H	H	OCH <sub>2</sub> H
H	H	SMe
H	H	SO <sub>2</sub> Me
H	H	NHMe
H	H	NMe <sub>2</sub>
H	Me	H
H	Me	Me
H	Me	NH <sub>2</sub>
H	Me	Et
H	Me	iso-Pr
H	Me	CF <sub>3</sub>
H	Me	OMe
H	Me	OCH <sub>2</sub> H
H	Me	SMe
H	Me	SO <sub>2</sub> Me
H	Me	NHMe
H	Me	NMe <sub>2</sub>
H	Et	H
H	Et	Me
H	Et	NH <sub>2</sub>
H	Et	Et
H	Et	iso-Pr
H	Et	CF <sub>3</sub>
H	Et	OMe
H	Et	OCH <sub>2</sub> H
H	Et	SMe
H	Et	SO <sub>2</sub> Me
H	Et	NHMe
H	Et	NMe <sub>2</sub>
H	iso-Pr	H
H	iso-Pr	Me
H	iso-Pr	NH <sub>2</sub>
H	iso-Pr	Et
H	iso-Pr	iso-Pr
H	iso-Pr	CF <sub>3</sub>
H	iso-Pr	OMe
H	iso-Pr	OCH <sub>2</sub> H
H	iso-Pr	SMe
H	iso-Pr	SO <sub>2</sub> Me
H	iso-Pr	NHMe
H	iso-Pr	NMe <sub>2</sub>
H	CF <sub>2</sub> H	H
H	CF <sub>2</sub> H	Me
H	CF <sub>2</sub> H	NH <sub>2</sub>
H	CF <sub>2</sub> H	Et
H	CF <sub>2</sub> H	iso-Pr
H	CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>
H	CF <sub>2</sub> H	OMe
H	CF <sub>2</sub> H	OCH <sub>2</sub> H

H	C F <sub>2</sub> H	S Me
H	C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> Me
H	C F <sub>2</sub> H	NHMe
H	C F <sub>2</sub> H	NMe <sub>2</sub>
H	C F <sub>3</sub>	H
H	C F <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
H	C F <sub>3</sub>	E t
H	C F <sub>3</sub>	i s o - P r
H	C F <sub>3</sub>	C F <sub>3</sub>
H	C F <sub>3</sub>	OMe
H	C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
H	C F <sub>3</sub>	S Me
H	C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> Me
H	C F <sub>3</sub>	NHMe
H	C F <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>
H	Me SO <sub>2</sub>	H
H	Me SO <sub>2</sub>	Me
H	Me SO <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>
H	Me SO <sub>2</sub>	E t
H	Me SO <sub>2</sub>	i s o - P r
H	Me SO <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
H	Me SO <sub>2</sub>	OMe
H	Me SO <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
H	Me SO <sub>2</sub>	S Me
H	Me SO <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> Me
H	Me SO <sub>2</sub>	NHMe
H	Me SO <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>
H	Me O <sub>2</sub> C	H
H	Me O <sub>2</sub> C	Me
H	Me O <sub>2</sub> C	NH <sub>2</sub>
H	Me O <sub>2</sub> C	E t
H	Me O <sub>2</sub> C	i s o - P r
H	Me O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
H	Me O <sub>2</sub> C	OMe
H	Me O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
H	Me O <sub>2</sub> C	S Me
H	Me O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> Me
H	Me O <sub>2</sub> C	NHMe
H	Me O <sub>2</sub> C	NMe <sub>2</sub>
H	C N	H
H	C N	Me
H	C N	NH <sub>2</sub>
H	C N	C N
H	C N	i s o - P r
H	C N	C F <sub>3</sub>
H	C N	OMe
H	C N	O C F <sub>2</sub> H
H	C N	S Me
H	C N	S O <sub>2</sub> Me
H	C N	NHMe
H	C N	NMe <sub>2</sub>
H	CH <sub>2</sub> OMe	H
H	CH <sub>2</sub> OMe	Me
H	CH <sub>2</sub> OMe	NH <sub>2</sub>
H	CH <sub>2</sub> OMe	E t
H	CH <sub>2</sub> OMe	i s o - P r
H	CH <sub>2</sub> OMe	C F <sub>3</sub>
H	CH <sub>2</sub> OMe	OMe

H	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
H	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
H	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
H	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
H	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
H	C H <sub>2</sub> S M e	H
H	C H <sub>2</sub> S M e	M e
H	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
H	C H <sub>2</sub> S M e	E t
H	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
H	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
H	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
H	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
H	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
H	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
H	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
H	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sub>2</sub>
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
H	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sub>2</sub>
H	C H <sub>2</sub> C N	H
H	C H <sub>2</sub> C N	M e
H	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
H	C H <sub>2</sub> C N	E t
H	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
H	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
H	C H <sub>2</sub> C N	O M e
H	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
H	C H <sub>2</sub> C N	S M e
H	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
H	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
H	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sub>2</sub>
H	H	H
H	H	N H <sub>2</sub>
H	H	E t
H	H	i s o - P r
H	H	C F <sub>3</sub>
H	H	O M e
H	H	O C F <sub>2</sub> H
H	H	S M e
H	H	S O <sub>2</sub> M e
H	H	N H M e
H	H	N M e <sub>2</sub>
M e	M e	H
M e	M e	M e
M e	M e	N H <sub>2</sub>
M e	M e	E t
M e	M e	i s o - P r
F	F	C F <sub>3</sub>

M e	O M e
M e	O C F <sub>2</sub> H
M e	S M e
M e	S O <sub>2</sub> M e
M e	N H M e
M e	N M e <sub>2</sub>
E t	H
E t	M e
E t	N H <sub>2</sub>
E t	E t
E t	i s o - P r
E t	C F <sub>3</sub>
E t	O M e
E t	O C F <sub>2</sub> H
E t	S M e
E t	S O <sub>2</sub> M e
E t	N H M e
E t	N M e <sub>2</sub>
i s o - P r	H
i s o - P r	M e
i s o - P r	N H <sub>2</sub>
i s o - P r	E t
i s o - P r	i s o - P r
i s o - P r	C F <sub>3</sub>
i s o - P r	O M e
i s o - P r	O C F <sub>2</sub> H
i s o - P r	S M e
i s o - P r	S O <sub>2</sub> M e
i s o - P r	N H M e
i s o - P r	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H	H
C F <sub>2</sub> H	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H	E t
C F <sub>2</sub> H	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H	O M e
C F <sub>2</sub> H	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H	S M e
C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H	N H M e
C F <sub>2</sub> H	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>3</sub>	H
C F <sub>3</sub>	M e
C F <sub>3</sub>	N H <sub>2</sub>
C F <sub>3</sub>	E t
C F <sub>3</sub>	i s o - P r
C F <sub>3</sub>	C F <sub>3</sub>
C F <sub>3</sub>	O M e
C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>3</sub>	S M e
C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>3</sub>	N H M e
C F <sub>3</sub>	N M e <sub>2</sub>
M e S O <sub>2</sub>	H
M e S O <sub>2</sub>	M e
M e S O <sub>2</sub>	N H <sub>2</sub>
M e S O <sub>2</sub>	E t
M e S O <sub>2</sub>	i s o - P r

F	M e S O <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
F	M e S O <sub>2</sub>	O M e
F	M e S O <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
F	M e S O <sub>2</sub>	S M e
F	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
F	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
F	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sup>2</sup>
F	M e O <sub>2</sub> C	H
F	M e O <sub>2</sub> C	M e
F	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
F	M e O <sub>2</sub> C	E t
F	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
F	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
F	M e O <sub>2</sub> C	O M e
F	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
F	M e O <sub>2</sub> C	S M e
F	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
F	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
F	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sup>2</sup>
F	C N	H
F	C N	M e
F	C N	N H <sub>2</sub>
F	C N	C N
F	C N	i s o - P r
F	C N	C F <sub>3</sub>
F	C N	O M e
F	C N	O C F <sub>2</sub> H
F	C N	S M e
F	C N	S O <sub>2</sub> M e
F	C N	N H M e
F	C N	N M e <sup>2</sup>
F	C H <sub>2</sub> O M e	H
F	C H <sub>2</sub> O M e	M e
F	C H <sub>2</sub> O M e	N H <sub>2</sub>
F	C H <sub>2</sub> O M e	E t
F	C H <sub>2</sub> O M e	i s o - P r
F	C H <sub>2</sub> O M e	C F <sub>3</sub>
F	C H <sub>2</sub> O M e	O M e
F	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
F	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
F	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
F	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
F	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sup>2</sup>
F	C H <sub>2</sub> S M e	H
F	C H <sub>2</sub> S M e	M e
F	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
F	C H <sub>2</sub> S M e	E t
F	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
F	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
F	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
F	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
F	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
F	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
F	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
F	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sup>2</sup>
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>

F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
F	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sub>2</sub>
F	C H <sub>2</sub> C N	H
F	C H <sub>2</sub> C N	M e
F	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
F	C H <sub>2</sub> C N	E t
F	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
F	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
F	C H <sub>2</sub> C N	O M e
F	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
F	C H <sub>2</sub> C N	S M e
F	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
F	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
F	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sub>2</sub>
C 1	H	H
C 1	H	M e
C 1	H	N H <sub>2</sub>
C 1	H	E t
C 1	H	i s o - P r
C 1	H	C F <sub>3</sub>
C 1	H	O M e
C 1	H	O C F <sub>2</sub> H
C 1	H	S M e
C 1	H	S O <sub>2</sub> M e
C 1	H	N H M e
C 1	H	N M e <sub>2</sub>
C 1	M e	H
C 1	M e	M e
C 1	M e	N H <sub>2</sub>
C 1	M e	E t
C 1	M e	i s o - P r
C 1	M e	C F <sub>3</sub>
C 1	M e	O M e
C 1	M e	O C F <sub>2</sub> H
C 1	M e	S M e
C 1	M e	S O <sub>2</sub> M e
C 1	M e	N H M e
C 1	M e	N M e <sub>2</sub>
C 1	E t	H
C 1	E t	M e
C 1	E t	N H <sub>2</sub>
C 1	E t	E t
C 1	E t	i s o - P r
C 1	E t	C F <sub>3</sub>
C 1	E t	O M e
C 1	E t	O C F <sub>2</sub> H
C 1	E t	S M e
C 1	E t	S O <sub>2</sub> M e
C 1	E t	N H M e
C 1	E t	N M e <sub>2</sub>
C 1	i s o - P r	H

C I	i s o - P r	M e
C I	i s o - P r	N H <sub>2</sub>
C I	i s o - P r	E t
C I	i s o - P r	i s o - P r
C I	i s o - P r	C F <sub>3</sub>
C I	i s o - P r	O M e
C I	i s o - P r	O C F <sub>2</sub> H
C I	i s o - P r	S M e
C I	i s o - P r	S O <sub>2</sub> M e
C I	i s o - P r	N H M e
C I	i s o - P r	N M e <sub>2</sub>
C I	C F <sub>2</sub> H	E t
C I	C F <sub>2</sub> H	i s o - P r
C I	C F <sub>2</sub> H	O M e
C I	C F <sub>2</sub> H	O C F <sub>2</sub> H
C I	C F <sub>2</sub> H	S M e
C I	C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> M e
C I	C F <sub>2</sub> H	N H M e
C I	C F <sub>2</sub> H	N M e <sub>2</sub>
C I	C F <sub>3</sub>	E t
C I	C F <sub>3</sub>	i s o - P r
C I	C F <sub>3</sub>	O M e
C I	C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C I	C F <sub>3</sub>	S M e
C I	C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C I	C F <sub>3</sub>	N H M e
C I	C F <sub>3</sub>	N M e <sub>2</sub>
C I	M e S O <sub>2</sub>	H
C I	M e S O <sub>2</sub>	M e
C I	M e S O <sub>2</sub>	N H <sub>2</sub>
C I	M e S O <sub>2</sub>	E t
C I	M e S O <sub>2</sub>	i s o - P r
C I	M e S O <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
C I	M e S O <sub>2</sub>	O M e
C I	M e S O <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C I	M e S O <sub>2</sub>	S M e
C I	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C I	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
C I	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sub>2</sub>
C I	M e O <sub>2</sub> C	H
C I	M e O <sub>2</sub> C	M e
C I	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
C I	M e O <sub>2</sub> C	E t
C I	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
C I	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
C I	M e O <sub>2</sub> C	O M e
C I	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
C I	M e O <sub>2</sub> C	S M e
C I	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
C I	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
C I	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sub>2</sub>
C I	C N	H
C I	C N	M e
C I	C N	N H <sub>2</sub>
C I	C N	C N
C I	C N	i s o - P r
C I	C N	C F <sub>3</sub>
C I	C N	O M e

C 1	C N	O C F <sub>2</sub> H
C 1	C N	S M e
C 1	C N	S O <sub>2</sub> M e
C 1	C N	N H M e
C 1	C N	N M e <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	H
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	M e
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	N H <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	E t
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	i s o - P r
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	C F <sub>3</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	O M e
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
C 1	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	H
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	M e
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	E t
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
C 1	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
C 1	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> C N	H
C 1	C H <sub>2</sub> C N	M e
C 1	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> C N	E t
C 1	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
C 1	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
C 1	C H <sub>2</sub> C N	O M e
C 1	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
C 1	C H <sub>2</sub> C N	S M e
C 1	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
C 1	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
C 1	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sub>2</sub>
B r	H	H
B r	H	M e
B r	H	N H <sub>2</sub>
B r	H	E t
B r	H	i s o - P r

B r	H	C F <sub>3</sub>
B r	H	O M e
B r	H	O C F <sub>2</sub> H
B r	H	S M e
B r	H	S O <sub>2</sub> M e
B r	H	N H M e
B r	H	N M e <sub>2</sub>
B r	H	H
B r	M e	M e
B r	M e	N H <sub>2</sub>
B r	M e	E t
B r	M e	i s o - P r
B r	M e	C F <sub>3</sub>
B r	M e	O M e
B r	M e	O C F <sub>2</sub> H
B r	M e	S M e
B r	M e	S O <sub>2</sub> M e
B r	M e	N H M e
B r	M e	N M e <sub>2</sub>
B r	E t	H
B r	E t	M e
B r	E t	N H <sub>2</sub>
B r	E t	E t
B r	E t	i s o - P r
B r	E t	C F <sub>3</sub>
B r	E t	O M e
B r	E t	O C F <sub>2</sub> H
B r	E t	S M e
B r	E t	S O <sub>2</sub> M e
B r	E t	N H M e
B r	E t	N M e <sub>2</sub>
B r	i s o - P r	H
B r	i s o - P r	M e
B r	i s o - P r	N H <sub>2</sub>
B r	i s o - P r	E t
B r	i s o - P r	i s o - P r
B r	i s o - P r	C F <sub>3</sub>
B r	i s o - P r	O M e
B r	i s o - P r	O C F <sub>2</sub> H
B r	i s o - P r	S M e
B r	i s o - P r	S O <sub>2</sub> M e
B r	i s o - P r	N H M e
B r	i s o - P r	N M e <sub>2</sub>
B r	C F <sub>2</sub> H	H
B r	C F <sub>2</sub> H	M e
B r	C F <sub>2</sub> H	N H <sub>2</sub>
B r	C F <sub>2</sub> H	E t
B r	C F <sub>2</sub> H	i s o - P r
B r	C F <sub>2</sub> H	C F <sub>3</sub>
B r	C F <sub>2</sub> H	O M e
B r	C F <sub>2</sub> H	O C F <sub>2</sub> H
B r	C F <sub>2</sub> H	S M e
B r	C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> M e
B r	C F <sub>2</sub> H	N H M e
B r	C F <sub>2</sub> H	N M e <sub>2</sub>
B r	C F <sub>3</sub>	H
B r	C F <sub>3</sub>	M e
B r	C F <sub>3</sub>	N H <sub>2</sub>

B r	C F <sub>3</sub>	E t
B r	C F <sub>3</sub>	i s o - P r
B r	C F <sub>3</sub>	C F <sub>3</sub>
B r	C F <sub>3</sub>	O M e
B r	C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
B r	C F <sub>3</sub>	S M e
B r	C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> M e
B r	C F <sub>3</sub>	N H M e
B r	C F <sub>3</sub>	N M e <sub>2</sub>
B r	C F <sub>3</sub>	H
B r	M e S O <sub>2</sub>	M e
B r	M e S O <sub>2</sub>	N H <sub>2</sub>
B r	M e S O <sub>2</sub>	E t
B r	M e S O <sub>2</sub>	i s o - P r
B r	M e S O <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
B r	M e S O <sub>2</sub>	O M e
B r	M e S O <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
B r	M e S O <sub>2</sub>	S M e
B r	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
B r	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
B r	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sub>2</sub>
B r	M e O <sub>2</sub> C	H
B r	M e O <sub>2</sub> C	M e
B r	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
B r	M e O <sub>2</sub> C	E t
B r	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
B r	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
B r	M e O <sub>2</sub> C	O M e
B r	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
B r	M e O <sub>2</sub> C	S M e
B r	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
B r	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
B r	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sub>2</sub>
B r	C N	H
B r	C N	M e
B r	C N	N H <sub>2</sub>
B r	C N	C N
B r	C N	i s o - P r
B r	C N	C F <sub>3</sub>
B r	C N	O M e
B r	C N	O C F <sub>2</sub> H
B r	C N	S M e
B r	C N	S O <sub>2</sub> M e
B r	C N	N H M e
B r	C N	N M e <sub>2</sub>
B r	C H <sub>2</sub> O M e	H
B r	C H <sub>2</sub> O M e	M e
B r	C H <sub>2</sub> O M e	N H <sub>2</sub>
B r	C H <sub>2</sub> O M e	E t
B r	C H <sub>2</sub> O M e	i s o - P r
B r	C H <sub>2</sub> O M e	C F <sub>3</sub>
B r	C H <sub>2</sub> O M e	O M e
B r	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
B r	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
B r	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
B r	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
B r	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
B r	C H <sub>2</sub> S M e	H

B r	C H <sub>2</sub> S Me	M e
B r	C H <sub>2</sub> S Me	N H <sub>2</sub>
B r	C H <sub>2</sub> S Me	E t
B r	C H <sub>2</sub> S Me	i s o - P r
B r	C H <sub>2</sub> S Me	C F <sub>3</sub>
B r	C H <sub>2</sub> S Me	O M e
B r	C H <sub>2</sub> S Me	O C F <sub>2</sub> H
B r	C H <sub>2</sub> S Me	S M e
B r	C H <sub>2</sub> S Me	S O <sub>2</sub> M e
B r	C H <sub>2</sub> S Me	N H M e
B r	C H <sub>2</sub> S Me	N M e <sup>2</sup>
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
B r	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sup>2</sup>
B r	C H <sub>2</sub> C N	H
B r	C H <sub>2</sub> C N	M e
B r	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
B r	C H <sub>2</sub> C N	E t
B r	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
B r	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
B r	C H <sub>2</sub> C N	O M e
B r	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
B r	C H <sub>2</sub> C N	S M e
B r	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
B r	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
B r	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sup>2</sup>
I	H	H
I	H	M e
I	H	N H <sub>2</sub>
I	H	E t
I	H	i s o - P r
I	H	C F <sub>3</sub>
I	H	O M e
I	H	O C F <sub>2</sub> H
I	H	S M e
I	H	S O <sub>2</sub> M e
I	H	N H M e
I	H	N M e <sup>2</sup>
I	M e	H
I	M e	M e
I	M e	N H <sub>2</sub>
I	M e	E t
I	M e	i s o - P r
I	M e	C F <sub>3</sub>
I	M e	O M e
I	M e	O C F <sub>2</sub> H
I	M e	S M e
I	M e	S O <sub>2</sub> M e
I	M e	N H M e

I	Me	N Me <sub>2</sub>
I	Et	H
I	Et	Me
I	Et	NH <sub>2</sub>
I	Et	Et
I	Et	iso-Pr
I	Et	CF <sub>3</sub>
I	Et	OMe
I	Et	OCH <sub>2</sub> H
I	Et	SMe
I	Et	SO <sub>2</sub> Me
I	Et	NHMe
I	Et	NMe <sub>2</sub>
I	iso-Pr	H
I	iso-Pr	Me
I	iso-Pr	NH <sub>2</sub>
I	iso-Pr	Et
I	iso-Pr	iso-Pr
I	iso-Pr	CF <sub>3</sub>
I	iso-Pr	OMe
I	iso-Pr	OCH <sub>2</sub> H
I	iso-Pr	SMe
I	iso-Pr	SO <sub>2</sub> Me
I	iso-Pr	NHMe
I	iso-Pr	NMe <sub>2</sub>
I	CF <sub>2</sub> H	H
I	CF <sub>2</sub> H	Me
I	CF <sub>2</sub> H	NH <sub>2</sub>
I	CF <sub>2</sub> H	Et
I	CF <sub>2</sub> H	iso-Pr
I	CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>
I	CF <sub>2</sub> H	OMe
I	CF <sub>2</sub> H	OCH <sub>2</sub> H
I	CF <sub>2</sub> H	SMe
I	CF <sub>2</sub> H	SO <sub>2</sub> Me
I	CF <sub>2</sub> H	NHMe
I	CF <sub>2</sub> H	NMe <sub>2</sub>
I	CF <sub>3</sub>	H
I	CF <sub>3</sub>	Me
I	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
I	CF <sub>3</sub>	Et
I	CF <sub>3</sub>	iso-Pr
I	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
I	CF <sub>3</sub>	OMe
I	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> H
I	CF <sub>3</sub>	SMe
I	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me
I	CF <sub>3</sub>	NHMe
I	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>
I	MeSO <sub>2</sub>	H
I	MeSO <sub>2</sub>	Me
I	MeSO <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>
I	MeSO <sub>2</sub>	Et
I	MeSO <sub>2</sub>	iso-Pr
I	MeSO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
I	MeSO <sub>2</sub>	OMe
I	MeSO <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> H
I	MeSO <sub>2</sub>	SMe

I	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
I	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
I	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sub>2</sub>
I	M e O <sub>2</sub> C	H
I	M e O <sub>2</sub> C	M e
I	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
I	M e O <sub>2</sub> C	E t
I	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
I	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
I	M e O <sub>2</sub> C	O M e
I	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
I	M e O <sub>2</sub> C	S M e
I	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
I	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
I	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sub>2</sub>
I	C N	H
I	C N	M e
I	C N	N H <sub>2</sub>
I	C N	C N
I	C N	i s o - P r
I	C N	C F <sub>3</sub>
I	C N	O M e
I	C N	O C F <sub>2</sub> H
I	C N	S M e
I	C N	S O <sub>2</sub> M e
I	C N	N H M e
I	C N	N M e <sub>2</sub>
I	C H <sub>2</sub> O M e	H
I	C H <sub>2</sub> O M e	M e
I	C H <sub>2</sub> O M e	N H <sub>2</sub>
I	C H <sub>2</sub> O M e	E t
I	C H <sub>2</sub> O M e	i s o - P r
I	C H <sub>2</sub> O M e	C F <sub>3</sub>
I	C H <sub>2</sub> O M e	O M e
I	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
I	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
I	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
I	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
I	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
I	C H <sub>2</sub> S M e	H
I	C H <sub>2</sub> S M e	M e
I	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
I	C H <sub>2</sub> S M e	E t
I	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
I	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
I	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
I	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
I	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
I	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
I	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
I	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sub>2</sub>
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
I	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e

I	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	O CF <sub>2</sub> H
I	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	S Me
I	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	S O <sub>2</sub> Me
I	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	NHMe
I	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>
I	CH <sub>2</sub> CN	H
I	CH <sub>2</sub> CN	Me
I	CH <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>
I	CH <sub>2</sub> CN	Et
I	CH <sub>2</sub> CN	iso-Pr
I	CH <sub>2</sub> CN	CF <sub>3</sub>
I	CH <sub>2</sub> CN	OMe
I	CH <sub>2</sub> CN	O CF <sub>2</sub> H
I	CH <sub>2</sub> CN	S Me
I	CH <sub>2</sub> CN	S O <sub>2</sub> Me
I	CH <sub>2</sub> CN	NHMe
I	CH <sub>2</sub> CN	NMe <sub>2</sub>
MeO	H	H
MeO	H	Me
MeO	H	NH <sub>2</sub>
MeO	H	Et
MeO	H	iso-Pr
MeO	H	CF <sub>3</sub>
MeO	H	OMe
MeO	H	O CF <sub>2</sub> H
MeO	H	S Me
MeO	H	S O <sub>2</sub> Me
MeO	H	NHMe
MeO	H	NMe <sub>2</sub>
MeO	Me	H
MeO	Me	Me
MeO	Me	NH <sub>2</sub>
MeO	Me	Et
MeO	Me	iso-Pr
MeO	Me	CF <sub>3</sub>
MeO	Me	OMe
MeO	Me	O CF <sub>2</sub> H
MeO	Me	S Me
MeO	Me	S O <sub>2</sub> Me
MeO	Me	NHMe
MeO	Me	NMe <sub>2</sub>
MeO	Et	H
MeO	Et	Me
MeO	Et	NH <sub>2</sub>
MeO	Et	Et
MeO	Et	iso-Pr
MeO	Et	CF <sub>3</sub>
MeO	Et	OMe
MeO	Et	O CF <sub>2</sub> H
MeO	Et	S Me
MeO	Et	S O <sub>2</sub> Me
MeO	Et	NHMe
MeO	Et	NMe <sub>2</sub>
MeO	iso-Pr	H
MeO	iso-Pr	Me
MeO	iso-Pr	NH <sub>2</sub>
MeO	iso-Pr	Et
MeO	iso-Pr	iso-Pr

M e O	i s o - P r	C F <sub>3</sub>
M e O	i s o - P r	O M e
M e O	i s o - P r	O C F <sub>2</sub> H
M e O	i s o - P r	S M e
M e O	i s o - P r	S O <sub>2</sub> M e
M e O	i s o - P r	N H M e
M e O	i s o - P r	N M e <sub>2</sub>
M e O	C F <sub>2</sub> H	H
M e O	C F <sub>2</sub> H	M e
M e O	C F <sub>2</sub> H	N H <sub>2</sub>
M e O	C F <sub>2</sub> H	E t
M e O	C F <sub>2</sub> H	i s o - P r
M e O	C F <sub>2</sub> H	C F <sub>3</sub>
M e O	C F <sub>2</sub> H	O M e
M e O	C F <sub>2</sub> H	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C F <sub>2</sub> H	S M e
M e O	C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C F <sub>2</sub> H	N H M e
M e O	C F <sub>2</sub> H	N M e <sub>2</sub>
M e O	C F <sub>3</sub>	H
M e O	C F <sub>3</sub>	M e
M e O	C F <sub>3</sub>	N H <sub>2</sub>
M e O	C F <sub>3</sub>	E t
M e O	C F <sub>3</sub>	i s o - P r
M e O	C F <sub>3</sub>	C F <sub>3</sub>
M e O	C F <sub>3</sub>	O M e
M e O	C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C F <sub>3</sub>	S M e
M e O	C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C F <sub>3</sub>	N H M e
M e O	C F <sub>3</sub>	N M e <sub>2</sub>
M e O	M e S O <sub>2</sub>	H
M e O	M e S O <sub>2</sub>	M e
M e O	M e S O <sub>2</sub>	N H <sub>2</sub>
M e O	M e S O <sub>2</sub>	E t
M e O	M e S O <sub>2</sub>	i s o - P r
M e O	M e S O <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
M e O	M e S O <sub>2</sub>	O M e
M e O	M e S O <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
M e O	M e S O <sub>2</sub>	S M e
M e O	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
M e O	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
M e O	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sub>2</sub>
M e O	M e O <sub>2</sub> C	H
M e O	M e O <sub>2</sub> C	M e
M e O	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
M e O	M e O <sub>2</sub> C	E t
M e O	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
M e O	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
M e O	M e O <sub>2</sub> C	O M e
M e O	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
M e O	M e O <sub>2</sub> C	S M e
M e O	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
M e O	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
M e O	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sub>2</sub>
M e O	C N	H
M e O	C N	M e
M e O	C N	N H <sub>2</sub>

M e O	C N	C N
M e O	C N	i s o - P r
M e O	C N	C F <sub>3</sub>
M e O	C N	O M e
M e O	C N	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C N	S M e
M e O	C N	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C N	N H M e
M e O	C N	N M e <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	H
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	M e
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	N H <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	E t
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	i s o - P r
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	C F <sub>3</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	O M e
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
M e O	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	H
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	M e
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	E t
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
M e O	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
M e O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> C N	H
M e O	C H <sub>2</sub> C N	M e
M e O	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> C N	E t
M e O	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
M e O	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
M e O	C H <sub>2</sub> C N	O M e
M e O	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
M e O	C H <sub>2</sub> C N	S M e
M e O	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
M e O	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
M e O	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	H	H

C F <sub>2</sub> H O	H	M e
C F <sub>2</sub> H O	H	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	H	E t
C F <sub>2</sub> H O	H	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	H	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	H	O M e
C F <sub>2</sub> H O	H	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	H	S M e
C F <sub>2</sub> H O	H	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	H	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	H	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e	H
C F <sub>2</sub> H O	M e	M e
C F <sub>2</sub> H O	M e	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e	E t
C F <sub>2</sub> H O	M e	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	M e	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e	O M e
C F <sub>2</sub> H O	M e	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	M e	S M e
C F <sub>2</sub> H O	M e	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	M e	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	M e	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	E t	H
C F <sub>2</sub> H O	E t	M e
C F <sub>2</sub> H O	E t	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	E t	E t
C F <sub>2</sub> H O	E t	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	E t	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	E t	O M e
C F <sub>2</sub> H O	E t	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	E t	S M e
C F <sub>2</sub> H O	E t	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	E t	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	E t	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	H
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	M e
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	E t
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	O M e
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	S M e
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	i s o - P r	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	H
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	E t
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	S M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	N H M e

C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>2</sub> H	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	H
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	E t
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	S M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	C F <sub>3</sub>	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	H
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	M e
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	E t
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	O M e
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	S M e
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	H
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	M e
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	E t
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	O M e
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	S M e
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C N	H
C F <sub>2</sub> H O	C N	M e
C F <sub>2</sub> H O	C N	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C N	C N
C F <sub>2</sub> H O	C N	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C N	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C N	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C N	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C N	S M e
C F <sub>2</sub> H O	C N	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C N	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	C N	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	E t
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> OMe	S M e

C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	E t
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	E t
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	O M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	S M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
C F <sub>2</sub> H O	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sub>2</sub>
C N	H	H
C N	H	N H <sub>2</sub>
C N	H	E t
C N	H	i s o - P r
C N	H	C F <sub>3</sub>
C N	H	O M e
C N	H	O C F <sub>2</sub> H
C N	H	S M e
C N	H	S O <sub>2</sub> M e
C N	H	N H M e
C N	H	N M e <sub>2</sub>
C N	M e	H
C N	M e	M e
C N	M e	N H <sub>2</sub>
C N	M e	E t
C N	M e	i s o - P r
C N	M e	C F <sub>3</sub>
C N	M e	O M e
C N	M e	O C F <sub>2</sub> H

C N	M e	S M e
C N	M e	S O <sub>2</sub> M e
C N	M e	N H M e
C N	M e	N M e <sub>2</sub>
C N	E t	H
C N	E t	M e
C N	E t	N H <sub>2</sub>
C N	E t	E t
C N	E t	i s o - P r
C N	E t	C F <sub>3</sub>
C N	E t	O M e
C N	E t	O C F <sub>2</sub> H
C N	E t	S M e
C N	E t	S O <sub>2</sub> M e
C N	E t	N H M e
C N	E t	N M e <sub>2</sub>
C N	i s o - P r	H
C N	i s o - P r	M e
C N	i s o - P r	N H <sub>2</sub>
C N	i s o - P r	E t
C N	i s o - P r	i s o - P r
C N	i s o - P r	C F <sub>3</sub>
C N	i s o - P r	O M e
C N	i s o - P r	O C F <sub>2</sub> H
C N	i s o - P r	S M e
C N	i s o - P r	S O <sub>2</sub> M e
C N	i s o - P r	N H M e
C N	i s o - P r	N M e <sub>2</sub>
C N	C F <sub>2</sub> H	H
C N	C F <sub>2</sub> H	N H <sub>2</sub>
C N	C F <sub>2</sub> H	E t
C N	C F <sub>2</sub> H	i s o - P r
C N	C F <sub>2</sub> H	C F <sub>3</sub>
C N	C F <sub>2</sub> H	O M e
C N	C F <sub>2</sub> H	O C F <sub>2</sub> H
C N	C F <sub>2</sub> H	S M e
C N	C F <sub>2</sub> H	S O <sub>2</sub> M e
C N	C F <sub>2</sub> H	N H M e
C N	C F <sub>2</sub> H	N M e <sub>2</sub>
C N	C F <sub>3</sub>	H
C N	C F <sub>3</sub>	M e
C N	C F <sub>3</sub>	N H <sub>2</sub>
C N	C F <sub>3</sub>	E t
C N	C F <sub>3</sub>	i s o - P r
C N	C F <sub>3</sub>	C F <sub>3</sub>
C N	C F <sub>3</sub>	O M e
C N	C F <sub>3</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C N	C F <sub>3</sub>	S M e
C N	C F <sub>3</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C N	C F <sub>3</sub>	N H M e
C N	C F <sub>3</sub>	N M e <sub>2</sub>
C N	M e S O <sub>2</sub>	H
C N	M e S O <sub>2</sub>	M e
C N	M e S O <sub>2</sub>	N H <sub>2</sub>
C N	M e S O <sub>2</sub>	E t
C N	M e S O <sub>2</sub>	i s o - P r
C N	M e S O <sub>2</sub>	C F <sub>3</sub>
C N	M e S O <sub>2</sub>	O M e

C N	M e S O <sub>2</sub>	O C F <sub>2</sub> H
C N	M e S O <sub>2</sub>	S M e
C N	M e S O <sub>2</sub>	S O <sub>2</sub> M e
C N	M e S O <sub>2</sub>	N H M e
C N	M e S O <sub>2</sub>	N M e <sub>2</sub>
C N	M e O <sub>2</sub> C	H
C N	M e O <sub>2</sub> C	M e
C N	M e O <sub>2</sub> C	N H <sub>2</sub>
C N	M e O <sub>2</sub> C	E t
C N	M e O <sub>2</sub> C	i s o - P r
C N	M e O <sub>2</sub> C	C F <sub>3</sub>
C N	M e O <sub>2</sub> C	O M e
C N	M e O <sub>2</sub> C	O C F <sub>2</sub> H
C N	M e O <sub>2</sub> C	S M e
C N	M e O <sub>2</sub> C	S O <sub>2</sub> M e
C N	M e O <sub>2</sub> C	N H M e
C N	M e O <sub>2</sub> C	N M e <sub>2</sub>
C N	C N	H
C N	C N	M e
C N	C N	N H <sub>2</sub>
C N	C N	C N
C N	C N	i s o - P r
C N	C N	C F <sub>3</sub>
C N	C N	O M e
C N	C N	O C F <sub>2</sub> H
C N	C N	S M e
C N	C N	S O <sub>2</sub> M e
C N	C N	N H M e
C N	C N	N M e <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> O M e	H
C N	C H <sub>2</sub> O M e	M e
C N	C H <sub>2</sub> O M e	N H <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> O M e	E t
C N	C H <sub>2</sub> O M e	i s o - P r
C N	C H <sub>2</sub> O M e	C F <sub>3</sub>
C N	C H <sub>2</sub> O M e	O M e
C N	C H <sub>2</sub> O M e	O C F <sub>2</sub> H
C N	C H <sub>2</sub> O M e	S M e
C N	C H <sub>2</sub> O M e	S O <sub>2</sub> M e
C N	C H <sub>2</sub> O M e	N H M e
C N	C H <sub>2</sub> O M e	N M e <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> S M e	H
C N	C H <sub>2</sub> S M e	M e
C N	C H <sub>2</sub> S M e	N H <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> S M e	E t
C N	C H <sub>2</sub> S M e	i s o - P r
C N	C H <sub>2</sub> S M e	C F <sub>3</sub>
C N	C H <sub>2</sub> S M e	O M e
C N	C H <sub>2</sub> S M e	O C F <sub>2</sub> H
C N	C H <sub>2</sub> S M e	S M e
C N	C H <sub>2</sub> S M e	S O <sub>2</sub> M e
C N	C H <sub>2</sub> S M e	N H M e
C N	C H <sub>2</sub> S M e	N M e <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	H
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	M e
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	E t
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	i s o - P r

C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	C F <sub>3</sub>
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O M e
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	O C F <sub>2</sub> H
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S M e
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	S O <sub>2</sub> M e
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N H M e
C N	C H <sub>2</sub> S O <sub>2</sub> M e	N M e <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> C N	H
C N	C H <sub>2</sub> C N	M e
C N	C H <sub>2</sub> C N	N H <sub>2</sub>
C N	C H <sub>2</sub> C N	E t
C N	C H <sub>2</sub> C N	i s o - P r
C N	C H <sub>2</sub> C N	C F <sub>3</sub>
C N	C H <sub>2</sub> C N	O M e
C N	C H <sub>2</sub> C N	O C F <sub>2</sub> H
C N	C H <sub>2</sub> C N	S M e
C N	C H <sub>2</sub> C N	S O <sub>2</sub> M e
C N	C H <sub>2</sub> C N	N H M e
C N	C H <sub>2</sub> C N	N M e <sub>2</sub>

本発明化合物のあるものは畑地、非耕地用除草剤として、土壤処理、茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、イヌホウズキ (*Solanum nigrum*)、チョウセンアサガオ (*Datura stramonium*)等に代表されるナス科 (Solanaceae) 雜草、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、アメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*) 等に代表されるアオイ科 (Malvaceae) 雜草、マルバアサガオ (*Ipomoea purpurea*) 等のアサガオ類 (*Ipomoea* spp.) やヒルガオ類 (*Calystegia* spp.) 等に代表されるヒルガオ科 (Convolvulaceae) 雜草、イヌビュ (*Amaranthus lividus*)、アオビュ (*Amaranthus retroflexus*) 等に代表されるヒュ科 (Amaranthaceae) 雜草、オナモミ (*Xanthium pensylvanicum*)、ブタクサ (*Ambrosia artemisiaefolia*)、ヒマワリ (*Helianthus annuus*)、ハキダメギク (*Galinsoga ciliata*)、セイヨウトゲアザミ (*Cirsium arvense*)、ノボロギク (*Senecio vulgaris*)、ヒメジョン (*Erigeron annus*) 等に代表されるキク科 (Compositae) 雜草、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、ノハラガラシ (*Sinapis arvensis*)、ナズナ (*Capsella Bursapastoris*) 等に代表されるアブラナ科 (Cruciferae) 雜草、イヌタデ (*Polygonum Blumei*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*) 等に代表されるタデ科 (Polygonaceae) 雜草、スペリヒュ (*Portulaca oleracea*) 等に代表されるスペリヒュ科 (Portulacaceae) 雜草、シロザ (*Chenopodium album*)、コアカザ (*Chenopodium ficifolium*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*) 等に代表されるアカザ科 (Chenopodiaceae) 雜草。

ceae) 雜草、ハコベ (*Stellaria media*) 等に代表されるナデシコ科 (*Caryophyllaceae*) 雜草、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雜草、ツユクサ (*Commelina communis*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雜草、ホトケノザ (*Lamium amplexicaule*)、ヒメオドリコソウ (*Lamium purpureum*) 等に代表されるシソ科 (*Labiatae*) 雜草、コニシキソウ (*Euphorbia supina*)、オオニシキソウ (*Euphorbia maculata*) 等に代表されるトウダイグサ科 (*Euphorbiaceae*) 雜草、ヤエムグラ (*Galium spurium*)、アカネ (*Rubia akane*) 等に代表されるアカネ科 (*Rubiaceae*) 雜草、スミレ (*Viola mandshurica*) 等に代表されるスミレ科 (*Violaceae*) 雜草、アメリカツノクサネム (*Sesbania exaltata*)、エビスグサ (*Cassia obtusifolia*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雜草等の広葉雑草 (Broad-leaved weeds)、野生ソルガム (*Sorghum bicolor*)、オオクサキビ (*Panicum dichotomiflorum*)、ジョンソングラス (*Sorghum halepense*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*)、ヒメイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *praticola*)、栽培ビエ (*Echinochloa utilis*)、メヒシバ (*Digitaria adscendens*)、カラスマギ (*Aven afatua*)、オヒシバ (*Eleusine indica*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、スズメノテッポウ (*Alopecurus aegualis*) 等に代表されるイネ科雑草 (Graminaceous weeds)、ハマスゲ (*Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (Cyperaceous weeds) 等の各種畠地雑草 (Cropland weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

又、水田用除草剤として湛水下の土壤処理及び茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ヘラオモダカ (*Alisma canaliculatum*)、オモダカ (*Sagittaria trifolia*)、ウリカワ (*Sagittaria pygmaea*) 等に代表されるオモダカ科 (*Alismataceae*) 雜草、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*)、ミズガヤツリ (*Cyperus serotinus*)、ホタルイ (*Scirpus juncoides*)、クログワイ (*Eleocharis kuroguwai*) 等に代表されるカヤツリグサ科 (*Cyperaceae*) 雜草、アゼナ (*Lindernia pyxidaria*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雜草、コナギ (*Monochoria vaginalis*) 等に代表されるミズアオイ科 (*Potenderiaceae*) 雜草、ヒルムシロ (*Potamogeton distinctus*) 等に代表されるヒルムシロ科 (*Potamogetonaceae*)

ceae) 雑草、キカシグサ (*Rotala indica*) 等に代表されるミソハギ科 (Lythraceae) 雑草、タイヌビエ (*Echinochloa oryzicola*)、ヒメタイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *formosensis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*) 雑草等、各種、水田雑草 (Paddy weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

さらに本発明化合物のあるものは、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ピート等に対して高い安全性を有する。

本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤または共力剤などと混合施用しても良い。

特に、他の除草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能である。

本発明化合物と混合使用するのに好ましい除草剤としては、例えば、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl／一般名)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl／一般名)、シノスルフロン (cinosulfuron／一般名)、イマゾスルフロン (imazosulfuron／一般名)、アジムスルフロン (azimsulfuron／一般名)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl／一般名)、プレチラクロール (pretilachlor／一般名)、エスプロカルブ (esprocarb／一般名)、ピラゾレート (pyrazolate／一般名)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen／一般名)、ベンゾフェナップ (benzofenap／一般名)、ダイムロン (daimuron／一般名)、ブロモブチド (bromobutide／一般名)、ナプロアニリド (naproanilide／一般名)、クロメプロップ (clomeprop／一般名)、CNP (一般名)、クロメトキシニル (chlomethoxynil／一般名)、ビフェノックス (bifenoxy／一般名)、オキサジアゾン (oxadiazon／一般名)、オキサジアルギル (一般名)、カフェンストロール (cafestrole／一般名)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone／一般名)、インダノファン (indanofan／一般名)、ペントキサゾン (pentoxazone／一般名)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl／一般名)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl／一般名)、フェントラザミド (fentraz

amide／一般名）、メフェナセット（mefenacet／一般名）、ブタクロール（butachlor／一般名）、ブテナクロール（butenachlor／一般名）、ジチオピル（dithiopyrl／一般名）、ベンフレセート（benfuresate／一般名）、ピリブチカルブ（pyributicarb／一般名）、ベンチオカーブ（benthiocarb／一般名）、ジメピペレート（dimepiperate／一般名）、モリネート（molinate／一般名）、ブタミフオス（butamifos／一般名）、キンクロラック（quinclorac／一般名）、シンメスリン（cinmethylin／一般名）、シメトリン（simetryn／一般名）、ベンスリド（bensulide／一般名）、ジメタメトリン（dimethametryn／一般名）、MCPA、MCPB、エトベンズアニド（etobenzanid）、クミルロン（cumyluron／一般名）、テニルクロール（thenylchlor／一般名）、エトキシスルフロン（ethoxysulfuron／一般名）、キノクラミン（quinoclamine／一般名）、ベンゾビシクロン（benzobicyclon／一般名）、ピリフトリド（pyriftalid／一般名）、ビスピリバック（bispyribac）、HSA-961（試験名）、アニロホス（anilofos／一般名）及びOK-701（試験名）等があげられる。

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体または液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤及び分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスボエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤及びゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することが出来る。また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することも出来る。なお必要に応じて、製剤または散布時に複数の他の除草剤、殺虫剤、殺菌剤、植物生長調整剤、肥料等と混合使用することも可能である。

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ペントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト及び珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム及び塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

液体担体としては、例えばエチレンギリコール、プロピレンギリコール及びイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼン及びアルキルナ

フタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサンノン等のケトン類、 $\gamma$ -ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油及びヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体及び液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホカク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリカルボン酸塩及びポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩及びアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型及びペタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

#### 〔水和剤〕

本発明化合物	0.1～80部
固体担体	5～98.9部
界面活性剤	1～10部
その他	0～5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

[乳 剤]

本発明化合物	0. 1 ~ 30 部
液体担体	45 ~ 95 部
界面活性剤	4. 9 ~ 15 部
その他	0 ~ 10 部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

[懸濁剤]

本発明化合物	0. 1 ~ 70 部
液体担体	15 ~ 98. 89 部
界面活性剤	1 ~ 12 部
その他	0. 01 ~ 30 部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

[顆粒水和剤]

本発明化合物	0. 1 ~ 90 部
固体担体	0 ~ 98. 9 部
界面活性剤	1 ~ 20 部
その他	0 ~ 10 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

[液 剤]

本発明化合物	0. 01 ~ 70 部
液体担体	20 ~ 99. 99 部
その他	0 ~ 10 部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

[粒 剤]

本発明化合物	0. 01 ~ 80 部
固体担体	10 ~ 99. 99 部
その他	0 ~ 10 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

## 〔粉 剂〕

本発明化合物	0 . 0 1 ~ 3 0 部
固体担体	6 5 ~ 9 9 . 9 9 部
その他	0 ~ 5 部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤を水で1~10000倍に希釈してまたは希釈せずに、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.001~50kg、好ましくは0.01~10kgになるように散布する。

## 製剤例

次に具体的に本発明化合物を有効成分とする農薬製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

## 〔配合例 1〕 水和剤

本発明化合物 N o . 1	2 0 部
バイロフィライト	7 6 部
ソルポール 5 0 3 9	2 部
(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名)	
カープレックス # 8 0 D	2 部

(合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

## 〔配合例 2〕 乳 剤

本発明化合物 N o . 1	5 部
キシレン	7 5 部
N-メチルピロリドン	1 5 部
ソルポール 2 6 8 0	5 部
(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名)	

以上を均一に混合して乳剤とする。

## 〔配合例 3〕懸濁剤（フロアブル剤）

本発明化合物 N o . 1	2 5 部
アグリゾール S - 7 1 0	1 0 部
(非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名)	
ルノックス 1 0 0 0 C	0 . 5 部
(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)	
キサンタンガム	0 . 2 部
水	6 4 . 3 部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

## 〔配合例 4〕顆粒水和剤（ドライフロアブル剤）

本発明化合物 N o . 1	7 5 部
ハイテノール N E - 1 5	5 部
(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬（株）商品名)	
バニレックス N	1 0 部
(アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名)	
カープレックス # 8 0 D	1 0 部
(合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名)	

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

## 〔配合例 5〕粒 剤

本発明化合物 N o . 1	· 5 部
ベントナイト	5 0 部
タルク	4 5 部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

## 〔配合例 6〕粉 剂

本発明化合物 N o . 1	3 部
カープレックス # 8 0 D	0 . 5 部
(合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名)	

カオリナイト	9 5 部
リン酸ジイソプロピル	1. 5 部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

#### 〔試験例 1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

33.3 cm<sup>2</sup>のスチロールカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し水深4 cmの湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ、コナギのそれぞれの種子を上記のポットに混播した後、2.5葉期のイネ苗を移植した。ポットを25～30℃の温室内に置いて植物を育成し、播種後1日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例1に準じて調整した本発明化合物の水和剤を水で希釈して処理した。処理後3週間目に、イネ及び各種雑草に対する除草効果の調査を行った。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第7表に示す。

#### 〔試験例 2〕湛水条件における雑草生育期処理による除草効果試験

33.3 cm<sup>2</sup>のスチロールカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し水深4 cmの湛水条件とした。ノビエの種子を上記のポットに混播した。ポットを25～30℃の温室内に置いて植物を育成し、ノビエ、ホタルイ、コナギが1～2葉期に達したとき、水面へ所定の薬量になるように、配合例1に準じて調整した本発明化合物の水和剤を水で希釈して処理した。処理後3週間目に、各種雑草に対する除草効果を試験例1の判定基準に従って調査を行った。結果を第8表に示す。

#### 〔試験例 3〕土壌処理による除草効果試験

縦21 cm、横13 cm、深さ7 cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスマギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5 cm覆土した後、有効成分量が所定の割合となるように土壌表面へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例1に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用い、これを全面に散布した。薬液散布3週間後に植物に対する

る除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査を行った。結果を第 9 表に示す。

[試験例 4] 茎葉処理による除草効果試験

縦 21 cm、横 13 cm、深さ 7 cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスマギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1.5 cm 覆土した後、25~30℃ の温室において植物を 14 日間育成し、有効成分量が所定の割合となるように茎葉部へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例 1 に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用い、これを全面に散布した。薬液散布 3 週間後に植物に対する除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査を行った。結果を第 10 表に示す。

なお、各表中の記号は次の意味を示す。

A (ノビエ)、B (ホタルイ)、C (コナギ)、D (メヒシバ)、E (エノコログサ)、F (カラスマギ)、G (ブラックグラス)、H (イチビ)、I (ブタクサ)、J (アオゲイトウ)、K (シロザ)、L (イヌタデ)、M (オオイヌノフグリ)、N (ハコベ)、a (移植イネ)、b (トウモロコシ)、c (ダイズ)、d (ワタ)、e (コムギ)、f (ビート)

[第 7 表]

化合物 No.	処理薬量 g/a	A	B	C	a
------------	-------------	---	---	---	---

1	10	1	1	2	0
2	10	5	5	5	2
3	2.52	5	5	5	2
4	2.52	5	5	5	4
5	10	3	1	4	1
6	10	4	5	5	1

7	2.52	5	5	5	5
12	2.52	5	5	5	5
14	10	2	2	1	0
15	10	3	4	5	1
16	10	4	4	5	0
18	10	2	2	5	0
19	10	5	4	5	1
22	20	5	5	5	2
23	10	0	2	2	0
24	2.52	5	5	5	4
25	10	2	2	1	0
26	10	3	1	5	1
27	10	2	2	2	0
29	2.52	5	5	5	2
30	2.52	5	4	5	2
31	2.52	4	3	5	1
32	2.52	5	5	5	2
33	2.52	4	5	5	2
35	2.2	4	4	5	2
36	10	2	5	4	0
37	10	4	5	5	1
38	20	5	5	5	-
39	2.52	5	5	5	2
40	2.52	5	5	5	4
41	2.52	5	5	5	5
42	2.52	5	5	5	4
43	2.52	5	5	5	4
44	2.52	5	5	5	4
45	2.52	5	5	5	1

46	2.52	5	5	5	5
47	2.52	3	0	5	1
49	2.52	5	5	5	2
51	2.52	5	5	5	4
52	2.52	5	5	5	3
53	2.52	5	4	5	3
54	2.52	5	5	5	1
55	2.52	5	5	5	5
56	2.52	5	5	5	3
57	2.52	5	5	5	3
58	2.52	5	5	5	3
59	2.52	5	5	5	3
60	2.52	4	3	5	0
61	2.52	5	5	5	5
62	2.52	5	4	5	2
63	2.52	5	5	5	1
65	2.52	4	-	5	5
66	2.52	5	5	5	3
67	2.52	4	5	5	3
68	2.52	5	-	5	2
69	2.52	5	-	5	4
70	2.52	5	-	5	4
71	2.52	5	5	5	3
72	2.52	5	5	5	2
74	2.52	5	-	5	4
75	2.52	0	-	5	1
76	2.52	5	5	5	2
77	2.52	5	5	5	3
78	2.52	5	5	5	5

79	2.52	5	5	5	4
80	2.52	5	4	5	2
81	2.52	4	2	5	1
82	2.52	2	2	5	0
83	2.52	4	2	5	2
84	2.52	3	4	5	2
85	2.52	5	5	5	3
86	2.52	5	5	5	4
87	2.52	5	3	5	2
88	2.52	4	3	5	4
89	2.52	4	3	5	3
90	2.52	4	1	5	4
91	2.52	5	5	5	4
92	2.52	5	5	5	4
93	2.52	5	5	5	5
94	2.52	5	5	5	5
95	2.52	5	4	5	4
96	2.52	5	5	5	5
97	2.52	5	4	5	5
98	2.52	5	4	5	5
99	2.52	5	5	5	3
100	2.52	5	5	5	5
101	2.52	5	5	5	4
102	2.52	5	4	5	2
103	2.52	5	5	5	3
104	2.52	5	5	5	5
105	2.52	5	5	5	2
106	2.52	5	4	5	3
107	2.52	3	2	5	1

108	2.52	2	2	5	1
109	2.52	4	2	5	1
110	2.52	4	3	5	2
111	2.52	0	1	5	1
112	2.52	2	1	5	2
113	2.52	2	2	5	2
114	2.52	4	3	5	3
115	2.52	5	3	5	2
116	2.52	5	4	5	3
117	2.52	0	1	5	1
118	2.52	5	5	5	3
119	2.52	5	4	5	2
120	2.52	5	5	5	5
121	2.52	5	5	5	2
122	2.52	5	4	5	4
123	2.52	5	4	5	5
124	2.52	5	4	5	5
125	0.64	5	5	5	2
126	0.64	0	0	2	0
127	0.64	5	4	5	3
128	0.64	5	4	5	2
129	0.64	4	3	5	1
130	0.64	2	1	5	1
131	0.64	0	0	3	1
132	0.64	5	4	5	2
133	0.64	4	3	5	1
134	0.64	5	2	5	1
135	0.64	5	3	5	2
136	0.64	5	3	5	2

137	0.64	5	4	5	2
138	0.64	3	1	5	0
139	0.64	5	4	5	3
140	0.64	4	5	5	3
141	0.64	5	4	5	2
142	0.64	3	2	5	1
143	0.64	5	5	5	2
144	0.64	3	1	5	1
145	0.64	2	0	5	1
146	0.64	5	1	5	2
147	0.64	2	0	5	1
148	0.64	0	0	5	0
149	0.64	5	2	5	2
150	0.64	5	2	5	1
151	0.64	5	2	5	1
152	0.64	5	3	5	1
153	0.64	5	3	5	2
154	0.64	4	1	5	1
155	0.64	5	3	5	1
156	0.64	5	1	5	1
157	0.64	5	2	5	2
159	0.64	4	3	5	2
160	0.64	3	2	5	2
161	0.64	0	0	5	0
162	0.64	1	1	5	0
163	0.64	4	2	5	1
164	0.64	4	2	5	1
165	0.64	5	5	5	1
166	0.64	5	5	5	1

167	0.64	5	2	5	1
168	0.64	5	3	5	0
169	0.64	5	3	5	1
170	0.64	5	3	5	1
171	0.64	5	5	5	1
172	0.64	5	3	5	0
173	0.64	5	3	5	1
174	0.64	5	3	5	1
175	0.64	5	3	5	1
176	0.64	4	2	5	0
177	0.64	4	2	5	1
178	0.64	3	2	5	0
179	0.64	4	2	5	0
180	0.64	4	2	5	1
181	0.64	3	2	5	1
182	0.64	0	1	5	1
183	0.64	5	2	5	1
184	0.64	4	3	5	2
185	0.64	3	1	5	1
186	0.64	2	1	5	1
187	0.64	3	2	5	2
188	0.64	0	0	5	1
189	0.64	2	1	5	1
190	0.64	2	2	5	1
191	0.64	0	0	5	0
192	0.64	0	0	5	0
193	0.64	0	0	5	1
194	0.64	2	1	5	1
195	0.64	2	2	5	0

196	0.64	5	5	5	2
197	0.64	5	4	5	3
198	0.64	5	5	5	2
199	0.64	5	5	5	2
200	0.64	5	5	5	2
201	0.64	1	0	1	0
230	0.64	2	1	5	0
202	2.52	4	2	5	1
203	2.52	5	3	5	2
204	2.52	5	5	5	2
205	2.52	4	2	5	1
206	2.52	5	5	5	3

〔第8表〕

化合物 No.	處理薬量 g/a	A	B	C
------------	-------------	---	---	---

1	10	2	1	2
2	10	5	4	4
3	2.52	5	5	5
4	2.52	5	5	5
5	10	2	1	2
6	10	2	2	2
7	2.52	5	5	5
12	2.52	5	5	5
14	10	1	2	1
15	10	3	3	3
16	10	4	3	3

18	10	2	2	3
19	10	5	2	3
22	20	5	3	3
23	10	0	0	1
24	2.52	5	4	5
25	10	1	1	0
26	10	1	1	0
27	10	2	2	1
29	2.52	3	2	3
30	2.52	4	3	4
31	2.52	0	1	3
32	2.52	5	4	4
33	2.52	4	3	4
35	2.2	5	4	4
36	10	1	1	2
37	10	2	2	3
38	20	5	5	5
39	2.52	4	4	5
40	2.52	5	4	5
41	2.52	5	5	5
42	2.52	5	5	5
43	2.52	5	5	5
44	2.52	5	4	5
45	2.52	5	4	5
46	2.52	5	5	5
47	2.52	5	3	3
49	2.52	5	4	4
51	2.52	5	4	4
52	2.52	5	4	5

53	2.52	5	5	5
54	2.52	4	2	3
55	2.52	5	5	5
56	2.52	5	5	5
57	2.52	5	4	5
58	2.52	5	5	5
59	2.52	5	4	5
60	2.52	1	0	0
61	2.52	5	5	5
62	2.52	5	3	4
63	2.52	5	3	3
65	2.52	4	5	5
66	2.52	4	-	5
67	2.52	5	-	5
68	2.52	3	4	5
69	2.52	5	4	5
70	2.52	5	-	5
71	2.52	4	4	5
72	2.52	5	2	5
74	2.52	3	2	4
75	2.52	1	1	3
76	2.52	4	2	3
77	2.52	4	2	3
78	2.52	5	3	5
79	2.52	5	3	5
80	2.52	3	1	3
82	2.52	0	2	5
83	2.52	3	1	5
84	2.52	2	1	5

85	2.52	5	2	4
86	2.52	5	2	4
87	2.52	2	1	2
88	2.52	2	0	3
89	2.52	2	1	3
90	2.52	1	0	1
91	2.52	5	3	3
92	2.52	5	2	4
93	2.52	5	4	4
94	2.52	5	4	5
95	2.52	4	1	2
96	2.52	5	3	4
97	2.52	3	1	1
98	2.52	4	2	3
99	2.52	4	2	2
100	2.52	5	2	4
101	2.52	5	2	3
102	2.52	3	2	3
103	2.52	5	3	4
104	2.52	5	3	4
105	2.52	5	2	4
106	2.52	5	2	3
107	2.52	2	1	5
108	2.52	2	2	5
109	2.52	1	1	5
110	2.52	2	2	5
111	2.52	1	0	4
112	2.52	2	1	3
113	2.52	2	0	3

114	2.52	5	2	2
115	2.52	4	1	2
116	2.52	5	2	3
117	2.52	0	1	4
118	2.52	5	2	2
119	2.52	2	2	2
120	2.52	5	2	4
121	2.52	4	2	4
122	2.52	5	1	2
123	2.52	4	2	3
124	2.52	5	2	2
125	0.64	4	2	2
127	0.64	3	2	3
128	0.64	5	2	2
130	0.64	0	0	5
132	0.64	1	1	1
133	0.64	3	0	2
134	0.64	1	0	0
135	0.64	4	1	2
136	0.64	1	1	2
137	0.64	5	2	2
138	0.64	2	1	2
139	0.64	4	2	5
140	0.64	5	2	3
141	0.64	3	1	3
142	0.64	2	1	0
143	0.64	4	2	2
144	0.64	1	0	1
145	0.64	0	0	2

146	0.64	4	1	2
148	0.64	0	0	2
149	0.64	5	1	1
150	0.64	4	0	1
151	0.64	1	0	0
152	0.64	2	1	0
154	0.64	4	1	2
156	0.64	5	2	2
157	0.64	4	2	2
159	0.64	1	0	2
160	0.64	0	0	2
164	0.64	1	0	2
165	0.64	1	0	2
166	0.64	2	0	1
167	0.64	1	0	3
168	0.64	1	0	0
169	0.64	3	1	1
170	0.64	3	1	2
171	0.64	0	0	2
172	0.64	0	0	1
173	0.64	0	0	1
174	0.64	0	0	2
175	0.64	0	0	1
178	0.64	0	0	2
179	0.64	0	0	1
182	0.64	0	0	1
183	0.64	2	0	1
184	0.64	3	1	4
185	0.64	1	1	4

186	0.64	0	1	5
187	0.64	0	2	5
188	0.64	1	0	4
189	0.64	0	1	3
190	0.64	1	1	5
191	0.64	0	0	5
192	0.64	0	1	3
193	0.64	0	0	5
194	0.64	1	0	4
195	0.64	2	0	2
196	0.64	4	2	5
197	0.64	5	2	5
198	0.64	5	2	4
199	0.64	5	1	5
200	0.64	0	0	3
202	2.52			
203	2.52			
204	2.52			
205	2.52			
206	2.52			
202	2.52	0	1	1
203	2.52	1	2	2
204	2.52	5	3	5
205	2.52	2	0	0
206	2.52	5	3	5

---

〔第9表〕

---

化合物 薬量

No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1	6.3	3	2	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0
2	6.3	5	5	3	4	1	4	5	5	5	5	0	1	0	-	4	0
3	6.3	5	5	4	4	5	3	5	5	5	5	1	3	1	2	4	5
4	6.3	5	5	3	3	5	5	5	5	5	5	4	1	5	3	5	
6	6.3	0	0	1	2	0	0	1	0	0	5	0	0	0	0	0	1
7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	1	5	5	
12	6.3	5	4	5	5	3	2	5	5	5	5	5	3	1	2	3	5
15	25	4	4	0	0	4	4	4	5	4	0	0	1	0	-	0	5
16	25	5	4	0	0	3	-	5	5	5	5	3	0	0	-	0	5
17	25	4	2	0	0	0	0	0	4	5	5	4	1	0	0	-	0
18	25	3	3	0	0	0	0	0	-	-	-	1	1	0	-	0	1
19	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	4	1	-	4	5
20	25	-	3	0	0	2	-	-	-	-	0	3	3	1	-	0	0
22	50	5	5	4	5	5	2	5	5	5	5	0	5	2	-	4	5
24	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	-	2	3	-	-	4	5
25	25	1	1	0	0	2	-	4	-	5	5	1	0	0	-	0	1
26	25	5	3	1	0	5	1	5	5	5	5	3	1	2	-	0	4
27	25	5	3	0	0	5	-	5	5	5	5	2	1	2	-	0	3
28	25	0	0	0	2	1	-	4	-	4	0	1	1	0	-	0	0
29	6.3	5	5	4	4	1	3	5	-	5	5	1	0	0	-	3	4
30	6.3	5	5	5	5	4	5	5	-	5	5	4	1	0	-	4	5
31	6.3	2	1	0	2	1	3	5	-	3	5	0	0	0	-	1	5
32	6.3	4	5	4	4	5	4	5	-	5	5	5	4	2	-	5	5
33	6.3	4	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	5	1	-	4	5
35	5.5	4	5	3	4	5	4	5	-	5	5	5	4	2	4	0	5
36	25	4	3	1	0	5	0	4	-	4	5	0	0	0	0	2	5
37	25	5	4	1	3	5	5	5	-	5	5	0	0	2	0	2	5

39	6.3	3	4	0	3	5	5	5	-	5	5	5	3	1	4	0	5
40	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	-	5	5
41	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	2	-	5	5
42	6.3	5	5	5	5	5	4	5	-	5	5	5	5	3	-	5	5
43	6.3	5	5	4	4	5	5	5	-	5	5	3	3	1	-	3	5
44	6.3	5	5	5	4	5	3	5	-	5	5	5	4	4	-	4	5
45	6.3	5	5	5	4	4	4	5	-	5	5	2	2	2	-	2	4
46	6.3	3	2	2	3	5	5	5	-	5	5	0	0	1	-	3	5
47	6.3	5	5	4	2	5	5	5	-	5	5	5	4	2	3	3	5
48	6.3	3	2	0	0	5	3	5	-	4	4	1	0	2	0	0	4
49	6.3	5	5	-	4	4	4	5	-	5	5	4	0	0	0	4	5
50	50	4	1	2	3	0	0	4	-	0	5	2	0	1	0	3	5
51	6.3	5	5	4	4	5	-	5	-	5	5	4	5	2	0	4	5
52	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	4	2	4	5
53	6.3	5	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	5	3	2	4	5
54	6.3	5	4	3	4	5	4	5	-	5	5	5	3	0	0	4	5
55	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	3	4	5
56	6.3	5	5	4	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	4	4	5
57	6.3	5	3	3	5	1	0	5	-	5	5	2	0	0	1	5	5
58	6.3	5	4	1	0	5	5	5	-	4	5	3	2	0	0	1	5
59	6.3	5	5	3	4	5	4	5	-	5	5	5	3	2	2	3	5
60	6.3	4	0	1	5	0	0	2	-	0	3	0	0	0	0	0	3
61	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	2	5	5	5
62	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	3	2	-	4	5
63	6.3	0	0	2	4	0	-	5	-	5	5	5	4	2	0	3	5
65	6.3	5	5	1	3	5	5	5	-	5	5	5	4	0	0	0	5
66	6.3	5	4	0	0	2	0	5	4	3	0	0	0	0	0	0	0
67	6.3	3	3	0	4	4	3	5	4	3	3	0	0	0	0	0	1
68	6.3	5	5	0	0	2	0	5	2	2	4	1	0	0	0	0	0

**WO 01/68613****PCT/JP01/02158**

69	6.3	5	5	0	0	5	4	5	5	5	4	1	1	0	0	0	0	0
70	6.3	4	4	0	2	3	5	5	5	5	5	1	2	0	0	1	5	
71	6.3	5	2	1	0	5	4	5	3	3	5	4	0	0	0	0	5	
72	6.3	5	3	4	2	2	2	5	5	5	-	5	4	0	1	0	1	5
74	6.3	4	3	0	2	5	3	5	5	5	-	5	3	-	-	-	1	5
75	6.3	0	0	1	0	4	4	5	5	5	-	5	0	0	0	0	0	5
76	6.3	5	4	3	2	1	0	5	5	5	5	1	0	0	0	0	0	2
77	6.3	4	0	1	1	0	4	5	5	5	5	0	2	0	0	1	5	
78	6.3	5	5	4	2	5	2	5	5	5	5	4	4	0	2	4	4	
79	6.3	5	3	3	0	2	0	5	5	5	5	2	2	0	0	2	2	
80	6.3	5	5	0	1	2	0	0	4	0	5	1	0	0	0	2	1	
81	6.3	0	0	1	0	0	0	4	0	0	4	0	0	0	0	1	1	
82	6.3	0	0	1	0	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5	
83	6.3	5	4	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	3	5	
84	6.3	1	2	0	4	5	5	5	5	5	5	4	1	0	2	1	5	
85	6.3	5	-	4	4	3	0	5	5	5	5	3	2	0	1	4	5	
86	6.3	5	-	4	5	2	0	5	5	5	5	3	0	0	0	4	5	
87	6.3	3	-	3	4	0	0	5	4	5	5	0	0	0	0	1	2	
88	6.3	3	-	1	3	2	0	5	5	4	2	1	0	0	0	2	3	
89	6.3	3	-	3	1	0	0	5	5	2	4	0	0	0	0	1	1	
90	6.3	3	-	1	2	0	0	5	5	5	3	1	0	0	0	1	5	
91	6.3	5	-	1	2	3	4	5	5	5	5	4	2	0	0	0	5	
92	6.3	5	-	4	4	3	0	5	5	5	5	3	0	0	1	2	5	
93	6.3	5	-	5	3	5	4	5	5	5	5	5	0	0	1	3	5	
94	6.3	5	-	5	5	5	3	5	5	5	5	5	3	2	2	3	5	
95	6.3	4	-	1	1	0	0	5	4	0	5	0	0	0	0	0	5	
96	6.3	5	-	5	5	5	3	5	5	5	5	4	4	2	0	5	5	
97	6.3	5	-	3	3	0	0	5	0	4	5	1	0	0	0	1	1	
98	6.3	5	-	3	1	2	2	5	4	5	5	2	0	0	0	1	5	

99	6.3	5	-	4	3	5	1	5	5	5	5	5	0	0	0	1	5
100	6.3	5	-	5	4	5	4	5	5	5	5	5	2	2	1	3	5
101	6.3	5	-	3	2	5	5	5	5	5	5	5	4	0	2	3	5
102	1.6	5	-	3	2	2	0	5	5	5	5	3	3	0	0	4	5
103	6.3	5	-	4	5	5	3	5	5	5	5	4	3	2	0	3	5
104	6.3	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	1	0	5	5
105	6.3	5	-	3	5	5	4	5	5	5	5	3	3	0	0	4	4
106	6.3	5	-	5	5	5	2	5	5	5	5	2	4	0	0	5	4
107	6.3	2	-	1	1	5	5	5	5	5	5	4	2	0	0	1	5
108	6.3	5	-	3	3	5	5	5	5	5	5	3	0	0	0	3	0
109	6.3	5	-	4	3	5	5	5	5	5	5	1	0	0	0	1	5
110	6.3	5	-	4	3	5	5	5	5	5	5	2	1	0	0	1	5
111	6.3	0	-	1	2	5	5	5	5	3	5	5	0	0	0	1	5
112	6.3	0	-	1	1	5	5	5	5	5	5	4	0	0	1	1	5
113	6.3	5	-	4	4	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	4	5
114	6.3	5	-	3	4	5	5	5	5	5	5	5	3	0	0	2	5
115	6.3	5	-	2	1	5	0	5	5	5	5	5	1	0	0	1	5
116	6.3	5	-	4	5	5	5	5	5	5	5	5	2	0	0	4	5
117	6.3	0	-	2	0	5	5	5	5	5	5	5	0	0	0	1	5
118	6.3	5	-	3	4	5	5	5	5	5	5	5	2	0	0	2	5
119	6.3	5	-	1	3	5	0	5	4	0	5	2	0	0	0	3	5
120	6.3	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	2	5	5	
121	6.3	5	-	4	4	4	4	5	4	5	5	3	1	0	0	4	2
122	6.3	5	-	3	3	5	4	5	5	5	5	3	3	2	0	4	5
123	6.3	5	-	4	2	5	4	5	5	5	5	3	4	1	0	3	5
124	6.3	5	-	4	5	5	4	5	5	5	5	5	4	3	0	4	5
125	1.6	5	-	3	2	3	0	5	5	5	5	3	2	0	0	3	5
126	1.6	0	-	1	1	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0
127	1.6	5	-	3	3	5	0	5	5	5	5	3	0	0	0	4	5

128	1.6	5	-	2	3	5	0	5	5	5	5	5	5	1	0	0	4	5
129	1.6	4	-	0	0	3	-	5	5	5	5	5	1	1	0	0	0	3
130	1.6	0	-	0	1	5	4	5	5	4	5	2	0	0	0	0	5	
131	1.6	4	-	1	1	0	0	4	5	5	5	0	0	0	0	1	5	
132	1.6	5	-	0	0	0	2	5	4	4	5	2	0	0	0	2	4	
133	1.6	5	-	1	2	4	0	5	5	5	5	5	2	0	0	2	5	
134	1.6	4	-	1	1	4	0	5	2	0	5	0	2	0	0	1	3	
135	1.6	5	-	3	1	5	3	5	5	5	5	5	2	0	0	4	5	
136	1.6	5	-	2	1	3	0	5	5	5	5	3	0	0	0	2	4	
137	1.6	5	-	3	3	5	4	5	5	5	5	4	3	0	0	4	5	
138	1.6	5	-	4	3	5	0	5	5	5	5	3	1	0	0	3	5	
139	1.6	5	-	4	3	5	4	5	5	5	5	3	3	0	0	3	5	
140	1.6	5	-	3	3	5	4	5	5	5	5	4	3	0	0	4	5	
141	1.6	5	-	2	1	4	0	5	5	5	5	0	0	0	0	1	3	
142	1.6	4	-	2	0	3	0	5	5	5	5	2	0	0	0	1	5	
143	1.6	5	-	3	3	3	0	5	5	5	5	4	4	0	0	3	4	
144	1.6	2	-	1	1	0	0	5	5	0	3	0	0	0	0	1	4	
145	1.6	3	-	2	1	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5	
146	1.6	5	-	4	3	5	0	5	5	5	5	5	2	0	0	4	5	
147	1.6	0	-	3	2	0	0	5	4	0	1	0	0	0	0	2	1	
148	1.6	0	-	3	2	0	0	5	4	4	3	0	0	0	0	2	1	
149	1.6	5	-	4	3	5	2	5	5	5	5	5	2	0	0	3	5	
150	1.6	5	-	3	2	5	0	5	5	5	5	4	4	0	0	2	5	
151	1.6	5	-	1	1	5	0	5	5	5	5	2	2	0	0	2	5	
152	1.6	5	-	2	2	5	3	5	5	5	5	1	2	0	0	1	5	
153	1.6	5	-	1	2	5	2	5	5	5	5	0	2	0	0	1	5	
154	1.6	5	-	2	1	4	5	5	5	5	5	4	3	0	0	3	5	
155	1.6	5	-	0	1	0	0	5	5	5	5	0	0	0	0	1	5	
156	1.6	5	-	3	3	5	0	5	5	5	5	4	2	0	0	2	5	

157	1.6	5	-	3	2	5	3	5	5	5	5	3	4	2	0	3	5
158	1.6	0	-	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0
159	1.6	0	-	0	1	3	4	5	4	4	5	2	0	0	0	1	4
160	1.6	4	-	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5
161	1.6	4	-	0	0	5	5	5	5	5	5	2	1	0	0	1	5
162	1.6	4	-	0	0	5	4	5	5	5	5	3	2	0	0	1	5
163	1.6	2	-	0	2	3	0	5	4	4	5	0	0	0	0	1	5
164	1.6	0	0	1	0	2	0	5	4	0	5	0	0	0	0	0	4
165	1.6	0	0	1	0	2	0	3	4	0	5	0	0	0	0	0	3
166	1.6	4	3	0	0	2	0	4	5	5	5	0	0	0	0	0	3
167	1.6	5	2	1	1	1	0	3	4	4	5	0	0	0	0	0	4
168	1.6	4	2	1	1	0	0	4	5	5	3	0	0	0	0	1	4
169	1.6	4	4	1	2	5	0	5	4	5	5	0	0	0	0	1	3
170	1.6	4	4	1	1	3	0	5	5	5	5	0	1	0	0	1	5
171	1.6	5	3	1	1	1	0	5	5	5	4	0	2	0	0	2	3
172	1.6	3	3	1	1	3	0	5	5	4	4	0	0	0	0	0	2
173	1.6	5	3	1	0	0	0	5	4	5	4	0	0	0	0	1	2
174	1.6	3	2	1	0	0	0	5	5	0	3	0	0	0	0	1	3
175	1.6	-	2	0	0	0	0	0	4	5	3	2	0	0	0	0	3
176	1.6	0	0	1	0	0	0	0	4	4	0	0	0	0	0	0	1
177	1.6	4	2	0	0	0	0	0	4	4	4	5	0	0	-	0	1
178	1.6	0	0	0	0	0	0	0	3	3	0	0	0	0	0	0	0
179	1.6	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	3
180	1.6	0	0	1	0	0	0	0	0	2	0	3	0	0	0	0	1
181	1.6	2	0	3	0	0	0	3	3	0	2	0	0	0	0	0	1
182	1.6	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	4	0	0	0	0	0
183	1.6	5	4	1	1	4	0	4	5	5	5	3	0	0	0	1	5
184	1.6	5	4	-	1	5	0	5	5	5	5	2	0	0	0	1	5
185	1.6	0	0	0	0	5	4	5	5	3	5	0	2	0	0	0	4

186	1.6	0	0	0	0	2	0	5	5	0	5	0	0	0	0	0	5	
187	1.6	3	0	-	1	5	4	5	5	2	5	0	0	0	0	1	5	
188	1.6	0	0	1	0	5	3	5	5	0	2	0	0	0	0	0	5	
189	1.6	0	0	0	0	2	3	0	4	0	5	0	0	0	0	1	5	
190	1.6	0	0	0	1	5	2	4	5	3	5	0	0	0	0	1	1	
191	1.6	0	0	1	0	0	0	3	5	0	5	0	0	0	0	0	4	
192	1.6	0	0	0	0	0	0	0	4	0	5	0	0	0	0	0	4	
193	1.6	0	0	0	1	2	4	5	5	3	5	0	0	0	0	0	5	
194	1.6	3	4	0	0	0	0	3	4	3	0	0	0	0	0	0	0	
195	1.6	4	4	1	0	0	0	5	5	0	5	0	0	0	0	0	0	
196	1.6	5	4	4	3	2	0	5	5	5	5	0	0	0	0	1	3	
197	1.6	5	5	4	3	3	0	5	5	5	5	3	1	0	0	1	4	
198	1.6	5	5	1	1	2	3	5	5	5	5	3	0	0	0	0	2	
199	1.6	5	4	1	1	2	0	5	5	5	5	2	0	0	0	0	3	
200	1.6	5	4	4	1	5	0	5	5	5	5	3	0	0	0	1	5	
230	1.6	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	1	
202	6.3	0	0	0	0	3	3	5	5	0	5	0	0	0	0	0	3	
203	6.3	4	0	2	3	4	5	5	5	5	5	1	0	0	0	2	5	
204	6.3	5	5	4	4	4	3	5	5	5	5	4	0	2	0	0	3	5
205	6.3	5	3	1	2	2	0	4	5	5	5	0	1	0	0	1	5	
206	6.3	4	5	4	3	5	4	5	5	5	5	0	0	0	0	3	5	

〔第10表〕

## 化合物 薬量

No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1	6.3	3	-	1	0	3	0	4	2	0	3	0	1	1	1	0	1
2	6.3	5	5	4	5	5	3	5	5	5	5	4	4	4	4	4	-

3	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	2	5
4	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	2	5
6	6.3	1	1	1	1	5	1	5	4	5	5	4	2	3	-	-	5
7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
12	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
13	6.3	1	1	0	1	4	1	3	4	5	2	1	1	2	1	0	4
14	6.3	1	1	0	0	2	0	2	2	2	3	0	1	2	0	0	1
15	25	4	4	1	1	5	-	5	5	4	5	0	2	4	4	1	5
16	25	5	4	2	2	5	3	5	5	5	5	1	2	4	5	1	5
17	25	1	1	1	1	4	3	5	5	5	5	2	0	2	4	2	1
18	25	2	1	1	1	2	1	5	-	5	4	5	1	2	2	1	3
19	25	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	3	5	4	4	5	5
22	50	5	4	5	5	5	2	5	5	5	-	0	5	4	-	5	5
23	6.3	0	0	2	0	-	-	-	-	-	2	1	0	1	-	0	2
24	6.3	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	3	4	-	4	5
25	25	2	2	2	1	4	1	5	4	5	-	2	0	2	-	1	2
26	25	4	3	2	1	5	-	5	5	5	-	1	3	2	-	0	5
27	25	4	3	0	0	3	2	4	3	4	5	0	2	2	-	0	4
28	25	2	2	2	1	3	4	4	4	4	2	2	1	2	-	1	0
29	6.3	4	4	4	5	5	5	5	-	5	5	4	2	2	-	5	5
30	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	4	5	4	-	5	5
31	6.3	2	1	2	2	3	5	5	-	5	5	5	1	3	-	2	5
32	6.3	4	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	4	-	4	5
33	6.3	4	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	4	3	-	4	5
35	5.5	3	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	3	5	5	5
36	25	2	2	1	2	4	4	4	-	4	5	2	1	3	2	2	2
37	25	5	4	0	5	5	5	5	-	5	5	1	2	4	3	2	5
39	6.3	4	4	4	3	5	5	5	-	5	5	5	5	4	5	3	5
40	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	-	5	5

41	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	-	5	5
42	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	-	5	5
43	6.3	5	5	5	4	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	-	4	5
44	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	4	5	5	5	-	5	5
45	6.3	5	5	5	4	5	5	5	-	5	4	4	4	3	3	-	3	5
46	6.3	5	5	4	3	5	5	5	-	5	5	5	4	3	3	-	4	5
47	6.3	5	5	3	2	5	5	5	-	5	5	5	4	5	5	3	5	
48	6.3	1	1	5	2	5	1	5	-	5	5	3	2	2	4	2	5	
49	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	
50	50	3	1	1	3	0	0	5	-	2	5	2	0	0	2	1	4	
51	6.3	5	5	5	5	5	4	5	-	5	5	4	5	4	5	4	5	
52	6.3	5	5	4	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	4	5	
53	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	5	5	5	
54	6.3	4	4	5	3	5	5	5	-	5	5	5	3	4	5	3	5	
55	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	
56	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	
57	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	3	0	5	5	4	5	
58	6.3	5	5	5	3	5	5	5	-	5	5	4	5	5	5	-	5	
59	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	-	-	5	5	5	5	-	
60	6.3	3	1	4	2	2	0	2	-	2	4	3	2	1	3	3	4	
61	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	
62	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	-	5	
63	6.3	5	5	4	4	5	2	5	-	5	5	5	4	4	5	3	5	
64	25	2	2	1	2	2	1	5	5	5	-	0	2	1	1	0	2	
65	6.3	5	5	4	2	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	
66	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	2	3	4	5	4	
67	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	3	4	5	3	5	
68	6.3	5	4	4	3	4	3	5	5	5	4	3	3	3	4	3	5	
69	6.3	5	5	4	3	5	5	5	5	4	3	4	5	5	3	5		

70	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	5	4	5
71	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	4	5	
72	6.3	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	4	5	
74	6.3	5	5	5	2	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5	3	5	
75	6.3	4	5	4	2	5	5	5	5	5	5	3	2	3	5	3	5	
76	6.3	5	5	4	4	5	4	5	5	5	5	4	4	3	4	3	5	
77	6.3	5	5	4	3	5	4	5	5	5	5	4	3	3	5	3	5	
78	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	4	5	
79	6.3	5	5	4	3	4	4	5	5	5	5	4	4	4	5	4	5	
80	6.3	4	3	4	3	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5	4	4	
81	6.3	0	0	4	2	5	2	5	5	5	5	3	2	2	3	2	3	
82	6.3	2	2	4	2	5	5	5	5	5	5	3	4	5	4	5		
83	6.3	5	3	4	2	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	
84	6.3	3	4	4	2	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	3	5	
85	6.3	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	
86	6.3	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	
87	6.3	3	4	5	3	5	0	5	5	5	5	4	4	2	4	4	5	
88	6.3	4	5	5	3	5	0	5	5	4	5	4	2	4	5	4	5	
89	6.3	3	5	5	4	5	0	5	4	5	5	4	3	3	4	3	5	
90	6.3	4	5	5	4	3	0	5	5	5	5	4	4	3	4	3	5	
91	6.3	5	4	5	3	5	4	5	5	5	5	4	2	4	5	4	5	
92	6.3	5	5	5	4	5	3	5	5	5	5	4	3	5	5	5		
93	6.3	5	4	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5		
94	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	
95	6.3	5	4	5	3	5	5	5	5	5	5	4	3	3	5	4	5	
96	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5	
97	6.3	5	5	5	3	5	4	5	5	5	5	5	3	5	4	5		
98	6.3	5	5	5	3	5	4	5	5	5	5	4	3	4	5	4	5	
99	6.3	5	5	5	3	5	5	5	4	5	5	4	4	4	5	5	5	

100	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
101	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5
102	1.6	5	4	4	4	5	4	5	5	5	5	5	5	3	5	3	5
103	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
104	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
105	6.3	5	4	5	4	5	4	5	5	5	5	5	4	3	5	4	5
106	6.3	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
107	6.3	0	4	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
108	6.3	2	4	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5
109	6.3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	5	4	5	2	5	3	5
110	6.3	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5	
111	6.3	0	3	4	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	5	4	5
112	6.3	1	4	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
113	6.3	4	3	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5
114	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
115	6.3	3	3	4	3	5	3	5	5	5	5	5	4	2	3	5	4
116	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
117	6.3	0	3	5	3	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5	4	5
118	6.3	4	3	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
119	6.3	2	4	4	4	5	4	5	4	4	5	4	2	3	4	4	5
120	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
121	6.3	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5
122	6.3	5	4	5	5	5	3	5	5	5	5	5	4	4	4	5	5
123	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
124	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
125	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	4
126	1.6	0	0	0	2	4	2	5	3	4	3	1	2	2	2	1	4
127	1.6	3	3	3	3	5	4	5	5	5	5	4	4	4	3	3	5
128	1.6	5	5	3	3	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	4

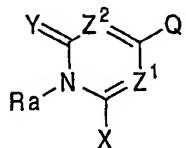
129	1.6	4	0	2	2	5	5	5	5	4	5	4	4	4	5	2	5
130	1.6	2	3	4	2	3	5	5	5	4	5	5	4	4	5	4	5
131	1.6	4	3	2	2	5	3	5	5	4	5	4	2	4	4	3	5
132	1.6	3	2	3	2	4	5	5	5	5	4	4	4	4	5	3	5
133	1.6	4	5	3	3	5	3	5	5	5	4	3	3	5	3	5	
134	1.6	4	3	2	2	5	5	5	5	4	5	3	5	3	5	2	5
135	1.6	5	5	3	3	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	
136	1.6	5	4	3	3	5	4	5	5	4	5	4	4	3	5	2	5
137	1.6	5	5	4	3	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	5	
138	1.6	5	3	2	3	5	0	5	5	5	5	3	3	2	4	3	5
139	1.6	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	
140	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	
141	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	4	4	3	5	3	5	
142	1.6	4	3	2	2	5	4	5	5	4	5	4	5	4	4	3	5
143	1.6	4	4	2	4	5	5	5	5	5	4	5	4	5	2	5	
144	1.6	0	2	2	2	5	2	5	5	4	5	4	2	2	2	2	4
145	1.6	3	3	3	2	5	5	5	5	4	5	4	4	3	5	2	5
146	1.6	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5
147	1.6	3	4	3	2	5	0	5	4	4	4	3	2	2	2	3	5
148	1.6	2	3	2	3	5	0	5	4	5	4	2	2	2	3	3	4
149	1.6	5	5	3	2	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5	
150	1.6	5	5	3	2	5	4	5	5	5	5	4	4	3	5	3	5
151	1.6	4	4	3	2	5	4	5	5	5	5	5	4	4	5	3	5
152	1.6	3	2	3	2	5	4	5	5	5	5	4	4	3	4	3	4
153	1.6	4	3	2	2	5	4	5	5	5	5	4	4	4	4	2	5
154	1.6	4	5	3	3	5	5	5	5	5	5	4	3	2	3	4	5
155	1.6	2	0	2	2	5	5	5	5	4	5	2	5	2	4	2	5
156	1.6	4	5	3	3	5	5	5	5	5	5	5	3	3	5	3	5
157	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	5

158	1.6	0	0	0	1	3	1	4	3	2	4	1	2	2	2	2	5
159	1.6	3	2	3	3	5	5	5	5	4	5	4	5	4	5	4	5
160	1.6	5	3	3	3	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5	4	5
161	1.6	2	2	3	2	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	5
162	1.6	2	0	2	2	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	3	5
163	1.6	0	0	1	2	5	5	5	5	5	5	2	2	3	3	2	5
164	1.6	0	0	3	3	5	5	5	5	4	5	4	2	2	5	2	5
165	1.6	0	0	3	3	5	5	5	5	4	5	4	3	2	5	3	5
166	1.6	3	1	2	2	5	3	5	5	4	5	4	2	2	4	2	5
167	1.6	3	2	4	3	5	5	5	5	5	4	3	2	5	3	5	
168	1.6	3	2	3	3	5	1	5	5	4	5	4	2	2	4	2	5
169	1.6	0	4	4	3	5	3	5	5	5	5	4	2	5	4	5	
170	1.6	3	4	4	3	5	3	5	5	5	5	5	2	2	4	4	5
171	1.6	0	0	4	3	5	4	5	5	5	5	4	2	1	4	3	5
172	1.6	4	2	4	3	5	3	5	5	4	5	4	3	1	5	3	5
173	1.6	3	3	4	3	5	3	5	5	5	5	4	2	2	4	4	5
174	1.6	3	0	3	3	5	4	5	5	4	5	4	2	1	5	3	5
175	1.6	3	0	4	3	5	4	5	5	5	5	3	2	-	5	3	5
176	1.6	3	0	3	3	5	4	5	5	4	5	3	2	2	5	3	5
177	1.6	3	0	3	3	5	3	5	5	4	5	3	3	2	4	4	5
178	1.6	0	0	3	2	5	5	5	5	3	5	3	3	1	5	2	5
179	1.6	0	2	3	3	5	4	5	5	4	5	3	2	2	4	2	5
180	1.6	0	0	3	3	5	4	5	5	5	5	3	2	2	4	2	5
181	1.6	0	0	2	3	5	4	5	5	4	5	4	3	2	4	3	5
182	1.6	0	0	3	3	5	4	5	5	4	5	3	3	1	4	3	5
183	1.6	3	3	4	4	5	4	5	5	5	5	4	3	2	5	4	5
184	1.6	5	3	4	4	5	5	5	5	4	5	5	2	3	5	5	5
185	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	3	5	4	5	1	5	4	5
186	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	4	5	5	5	2	5	3	5

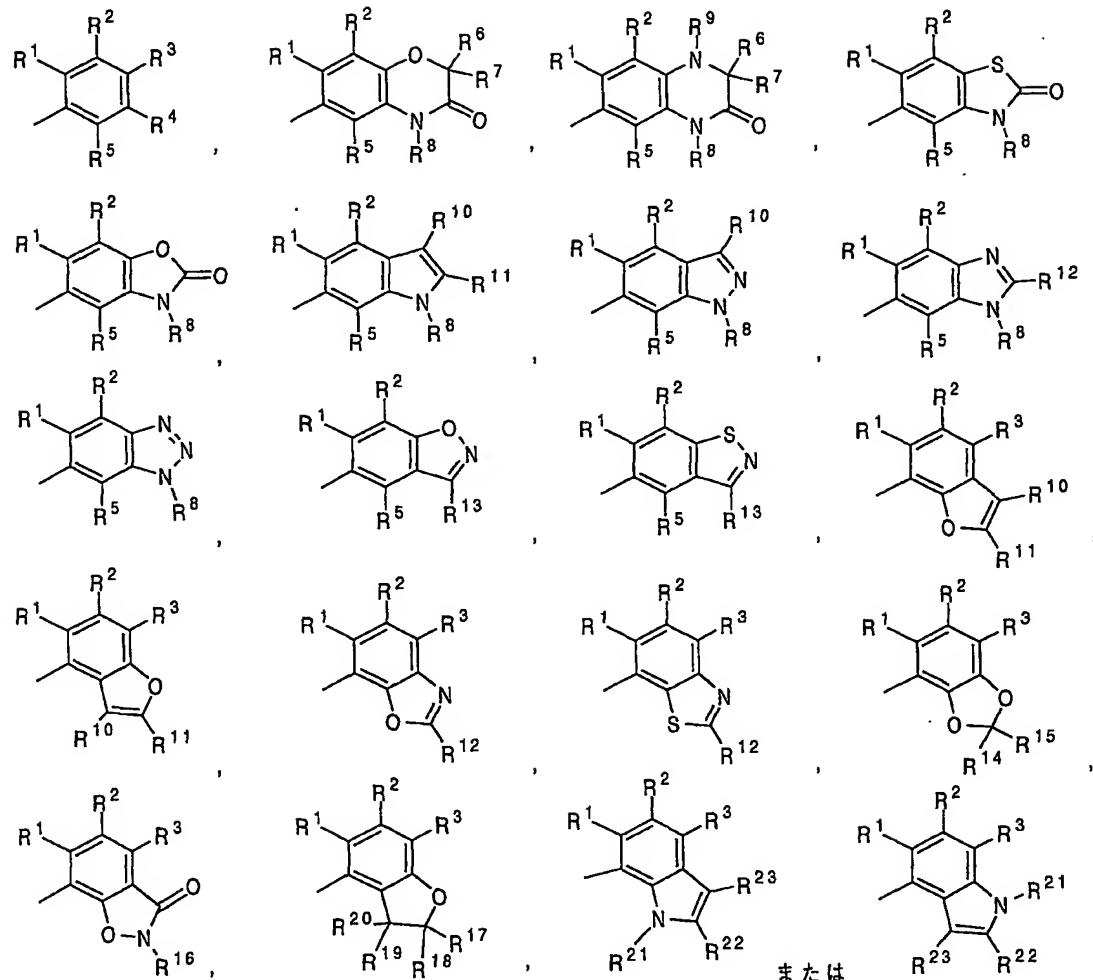
187	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	4	5	5	5	2	5	4	5
188	1.6	0	0	4	4	5	5	5	5	5	5	4	4	3	5	3	5
189	1.6	0	0	5	3	5	5	5	5	4	5	5	2	3	5	4	5
190	1.6	0	0	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	2	5	4	5
191	1.6	0	0	3	3	5	5	5	5	4	5	4	4	2	5	3	5
192	1.6	0	0	3	3	5	4	5	5	4	5	4	4	2	5	3	5
193	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	4	5	4	4	3	5	3	5
194	1.6	2	4	3	3	2	1	5	4	5	5	3	2	2	4	3	5
195	1.6	0	3	3	3	5	2	5	5	5	5	3	2	2	4	4	5
196	1.6	5	3	4	5	5	4	5	5	5	5	4	4	2	5	4	5
197	1.6	5	3	4	4	5	4	5	5	5	5	5	2	3	5	4	5
198	1.6	5	3	4	4	5	4	5	5	5	5	5	2	2	5	3	5
199	1.6	4	3	5	4	5	4	5	5	5	5	5	3	3	5	5	5
200	1.6	5	3	4	4	4	4	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
201	1.6	0	0	1	2	3	2	4	2	2	5	2	1	1	2	1	5
230	1.6	0	0	1	2	3	0	5	4	3	4	2	1	3	2	2	4
202	1.6	1	5	3	3	5	5	5	5	4	5	4	2	2	5	2	5
203	1.6	1	5	4	4	5	5	5	5	5	4	3	4	5	4	5	5
204	1.6	3	5	4	4	5	3	5	5	5	5	4	3	3	4	4	5
205	1.6	3	5	3	2	4	0	5	4	4	5	1	4	2	3	3	2
206	1.6	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	4	5

## 請求の範囲

1. 式(1) :



〔式中、Qは式(2) :



を表し、

Raは水素原子、シアノ基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、シアノC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基  
、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アル

キル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、 $(C_1-C_4$ アルキル)カルボニル基または $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基を表し、

$X$ は水素原子、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1-C_4$ アルキルチオ基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、アミノ基、 $C_1-C_4$ アルキルアミノ基、または $(C_1-C_4$ アルキル) $_2$ アミノ基を表し、

$Y$ は酸素原子または硫黄原子を表し、

$Z^1$ および $Z^2$ はそれぞれ独立して窒素原子またはCR<sub>b</sub>を表し、但し、 $Z^1$ が窒素原子を表すときは $Z^2$ はCR<sub>b</sub>を表し、 $Z^1$ がCR<sub>b</sub>を表すときは $Z^2$ は窒素原子を表し、

R<sub>b</sub>は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルコキシ基またはシアノ基を表し、

$R^1$ および $R^2$ はそれぞれ独立しては水素原子またはハロゲン原子を表し、

$R^3$ は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基、アミノ基、ホルミル基、カルボキシル基、シアノメチル基、 $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル基、スルファモイル基、チオカルバモイル基、カルバモイル基、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1-C_4$ アルキルチオ基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、トリメチルシリルエチニル基、 $C_1-C_4$ アルキルアミノ基、 $(C_1-C_4$ アルキル) $_2$ アミノ基、置換フェニル基、置換フェニルカルボニル基、置換フェニルカルボニルオキシ基、置換フェニルメチル基、置換フェニルスルホニル基、置換フェニル-L-O、置換フェニル-L-NH、置換フェニル-L-Sまたは $C_1-C_4$ アルキルO C(O)-L-Oを表し、

$R^4$ は水素原子、ハロゲン原子、ホルミルアミノ基、シアノ基、クロロスルホニル基、ニトロ基、ヒドラジノ基、置換フェニル基、1,3-ジオキサン-2-イル基、1,3-ジオキサン-2-イル基、 $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_1-C_8$ ハロ

アルキル基、 $C_3-C_8$ ハロゲノシクロアルキル基、 $C_2-C_8$ ハロアルケニル基、 $C_2-C_8$ ハロアルキニル基、( $C_1-C_6$ アルキル)カルボニル基、( $C_1-C_6$ ハロアルキル)カルボニル基、 $R^{30}O$ 、 $R^{30}-L-O$ 、 $R^{30}C(O)-L-O$ 、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、2-ピリミジニルオキシ基、2-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基、5-クロロ-2-ピリジルオキシ基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、 $R^{30}S$ 、 $R^{30}NH$ 、 $R^{31}OC(O)$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)$ 、 $R^{33}SO_2NHC(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L$ 、 $R^{30}C(O)-R^{30}-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)-L-NH$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-NH$ 、 $R^{30}C(O)-L-NH$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L-SO_2$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-S$ 、 $R^{30}C(O)-L-S$ 、 $R^{34}SO_2NH$ 、 $(R^{34}SO_2)_2N$ 、 $R^{34}SO_2(R^{35})N$ 、 $R^{36}OC(O)NH$ 、 $R^{36}OC(O)(R^{35})N$ 、 $R^{31}OC(O)-L-(R^{35})N$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-(R^{35})N$ 、置換フェニル( $R^{35})N$ 、 $R^{30}R^{35}N$ 、 $R^{36}CONH$ 、 $R^{36}C(O)(R^{35})N$ 、 $R^{37}ON=C(H)$ 、( $C_1-C_4$ アルコキシ) $_2P(O)-L$ 、 $R^{30}O-L$ 、 $R^{30}S-L$ 、 $R^{30}NH-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L$ 、 $R^{30}S(O)-L$ 、 $R^{30}SO_2-L$ 、 $NC-L$ 、 $R^{30}CO_2-L$ 、 $R^{30}C(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NCO_2$ 、 $(R^{38}O)R^{31}NC(O)-L$ 、(2-クロロ-4-ブタノリド-2-イル) $C_1-C_4$ アルキル基、 $R^{38}-O-N=C(R^{37})-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)C_1-C_4$ アルキレン-O-C(=NOR<sup>38</sup>)-L、 $R^{30}C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{30}-O-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-S$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NNR^{31}R^{32})-L$ 、( $C_1-C_4$ アルキル) $_3Si-L-O$ 、( $C_1-C_4$ アルキル) $_3Si-L-O-CH_2-O$ または置換されていてもよい5~6員のヘテロ環を表し、  
 $R^5$ は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル基、メルカプト基、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$

$C_8$ アルキニル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニルオキシ基、 $C_2-C_8$ アルキニルオキシ基、2, 3-エポキシ-2-メチルプロピル基または2-メチル-2-プロペニル基を表し、

$R^6$ および $R^7$ はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、シアノ基または $C_1-C_6$ ハロアルキル基を表し、

$R^8$ および $R^9$ はそれぞれ独立して水素原子、 $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_1-C_8$ ハロアルキル基、 $C_2-C_8$ ハロアルケニル基、 $(C_1-C_6$ アルキル)カルボニル基、 $(C_1-C_6$ ハロアルキル)カルボニル基、ホルミル基、ベンゾイル基、フェナシル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6$ アルコキシ)カルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $N C-L$ 、 $R^{31}O C(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}N C(O)-L$ 、 $R^{39}O C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{31}R^{32}N C(=OR^{38})-L$ 、 $R^{31}O C(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}N C(O)-L-O$ 、 $R^{39}O C(=NOR^{38})-L-O$ または置換フェニル-Lを表し、

$R^{10}$ は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基または $(C_1-C_4$ アルキル)カルボニル基を表し、

$R^{11}$ は水素原子、ホルミル基、カルボキシル基、ヒドロキシメチル基、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ ハロアルキル基、 $(C_1-C_6$ アルキル)カルボニル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルキルチオ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基、 $(C_1-C_4$ アルキル)アミノカルボニル基、 $C_1-C_4$ アルキル-CH(OH)、 $C_2-C_4$ アルケニル-CH(OH)、 $C_3-C_8$ シクロアルキル-CH(OH)または $(C_3-C_8$ シクロアルキル)カルボニル基を表し、

$R^{12}$ は水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ ハロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基または $C_1-C_4$ アルコキシ( $C_1-C_4$ )アルキル基を表し、

$R^{13}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基または置換フェニル基を表し、

$R^{14}$  および  $R^{15}$  はそれぞれ独立して水素原子または  $C_1-C_6$  アルキル基を表し

$R^{16}$ は水素原子または $C_1-C_6$ アルキル基を表し、  
 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ および $R^{20}$ はそれぞれ独立して水素原子または $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{21}$  は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $(C_1-C_6\text{アルキル})$ カルボニル基、 $(C_1-C_6\text{ハロアルキル})$ カルボニル基、 $(C_1-C_6\text{アルコキシ})$ カルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_6$ ハロアルキルスルホニル基または $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基を表し、

$R^{22}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、ヒドロキシ $C_1-C_4$ アルキル基または $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基を表し、

$R^{23}$  は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ニトロ基、アミノ基、シアノ基、ホルミル基、 $(C_1-C_6\text{アルキル})\text{カルボニル基}$ 、 $(C_1-C_4\text{ハロアルキル})\text{カルボニル基}$ 、カルボキシリル基、 $(C_1-C_4\text{アルコキシ})\text{カルボニル基}$ 、ヒドロキシ $C_1-C_4\text{アルキル基}$ 、 $C_1-C_4\text{アルキルチオ基}$ 、 $C_1-C_4\text{アルキルスルホニル基}$ 、 $R^{38}\text{ON=CH}$  または  $R^{38}\text{ON=C}(C_1-C_4\text{アルキル})$  を表し

R<sup>30</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、4—ブタノリド—2—イル基、5—ペンタノリド—2—イル基、6—ヘキサノリド—2—イル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシ)カルボニル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>アミノカルボニル基、C<sub>3</sub>—C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(テトラヒドロフラン—2—イル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(2, 2—ジメチル—1, 3—ジオキソラン—4—イル)メチル基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(テトラヒドロピラン—2—イル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、(フラン—2—イル)C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルケニルオキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>—C<sub>8</sub>アルキニルオキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>ハロアルコキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アル

ルキル基、置換フェニルオキシ  $C_1-C_4$  アルキル基、 $C_1-C_4$  ハロアルコキシ  $C_1-C_4$  アルコキシ  $C_1-C_4$  アルキル基、置換フェニル  $C_2-C_8$  アルキニル基、置換フェニル  $C_2-C_8$  アルケニル基、シアノ  $C_1-C_4$  アルキル基、 $C_1-C_4$  アルコキシ  $C_1-C_4$  アルキル基、 $C_1-C_4$  アルキルチオ  $C_1-C_4$  アルキル基、ベンジルオキシメチル基、テトラヒドロピラン-2-イル基、オキシラニル基、オキシラニルメチル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、( $C_1-C_8$  アルキル)カルボニル基、シアノ  $C_2-C_8$  アルケニル基、( $C_1-C_4$  ハロアルキル)カルボニル基、置換フェニル基、(テトラヒドロフラン-3-イル)  $C_1-C_4$  アルキル基、(3-メチルオキセタン-3-イル)  $C_1-C_4$  アルキル基、( $2-\text{ピロリドン}-1$ -イル)  $C_1-C_4$  アルキル基、( $C_2-C_8$  アルケニル)カルボニル基、( $C_1-C_4$  アルコキシ  $C_1-C_4$  アルキル)カルボニル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、 $C_1-C_8$  アルキルスルホニル基、 $C_1-C_8$  ハロアルキルスルホニル基、( $C_1-C_4$  アルキル)カルボニルオキシ  $C_1-C_4$  アルキル基、( $C_1-C_4$  ハロアルコキシ)カルボニル基、(置換されていてもよい5から6員ヘテロ環)  $C_1-C_4$  アルキル基、テトラヒドロピラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-4-イル基、(テトラヒドロピラン-3-イル)  $C_1-C_4$  アルキル基、(テトラヒドロピラン-4-イル)  $C_1-C_4$  アルキル基または1-メチルピロリジン-3-イル基を表し、

$R^{31}$ は水素原子、 $C_1-C_8$  アルキル基、 $C_2-C_8$  アルケニル基、 $C_2-C_8$  アルキニル基、 $C_3-C_8$  シクロアルキル基、 $C_3-C_8$  シクロアルキル  $C_1-C_4$  アルキル基、 $C_1-C_6$  ハロアルキル基、 $C_1-C_4$  アルコキシ  $C_1-C_4$  アルキル基、オキセタン-3-イル基、 $C_1-C_4$  アルキルアミノ基、( $C_1-C_4$  アルキル)<sub>2</sub>アミノ基、 $C_1-C_4$  アルキリデンイミノ基、置換されていてもよいフェニル基、ベンジル基、( $C_2-C_8$  アルケニル)オキシカルボニル  $C_1-C_4$  アルキル基、( $C_2-C_8$  アルキニル)オキシカルボニル  $C_1-C_4$  アルキル基、( $C_1-C_4$  アルコキシ)カルボニル  $C_1-C_4$  アルキル基、(テトラヒドロフラン-2-イル)  $C_1-C_4$  アルキル基、( $C_1-C_4$  アルキル)<sub>2</sub>アミノ  $C_1-C_4$  アルキル基、置換されていてもよい5から6員ヘテロ環、 $C_2-C_6$  ハロアルケニル基または $C_1-C_4$  アルキルチオ  $C_1-C_4$  アルキル基を表し、

$R^{32}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基または $C_1-C_6$ ハロアルキル基を表し、但し、 $R^{31}$ と $R^{32}$ は結合している窒素原子とともに $C_1-C_4$ アルキル基で置換されていても良い3から8員のヘテロ環を表してもよく、そのときのヘテロ環の構成要素は炭素、酸素、硫黄および窒素原子から任意に選択され、

$R^{33}$ は $C_1-C_4$ アルキル基または $C_1-C_4$ ハロアルキル基を表し、

$R^{34}$ は $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、ベンジル基またはフェニル基を表し、

$R^{35}$ は $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_2-C_8$ ハロアルケニル基、 $C_2-C_8$ ハロアルキニル基、シアノ $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基、( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基、( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルキル基、ホルミル基、( $C_1-C_6$ アルキル)カルボニル基、( $C_1-C_6$ ハロアルキル)カルボニル基または置換フェニルカルボニル基を表し、

$R^{36}$ は $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、置換フェニル基または置換フェニル $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{37}$ は $C_1-C_6$ アルキル基または( $C_1-C_3$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_6$ アルキル基を表し、

$R^{38}$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、 $C_3-C_8$ シクロアルキル基またはベンジル基を表し、

$R^{39}$ は $C_1-C_8$ アルキル基、 $C_2-C_8$ アルケニル基、 $C_2-C_8$ アルキニル基、( $C_1-C_6$ アルキル)カルボニル基、( $C_1-C_6$ アルコキシ)カルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基または( $C_1-C_4$ アルコキシ) $_2P(O)$ を表し、

$L$ は飽和あるいは不飽和の分岐してもよく、ハロゲン原子、シアノ基または( $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基によって置換されていてもよい $C_1-C_6$ のアルキレン鎖を表し、

置換フェニルはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル

基、ヒドロキシ基、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、 $(C_1-C_4$ アルキル)カルボニル基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルキルオキシ基、 $OCH(CH_3)CO_2H$ 、 $OCH_2CO_2H$ 、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルコキシ基または $(C_1-C_4$ ハロアルコキシ $C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよいフェニル基を表し、

置換されていてもよい5から6員ヘテロ環はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル基、ヒドロキシ基、 $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基、 $(C_1-C_4$ アルキル)カルボニル基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル $C_1-C_4$ アルキルオキシ基、 $OCH(CH_3)CO_2H$ 、 $OCH_2CO_2H$ または $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基によって任意に置換されていてもよい5から6員ヘテロ環を表し、

但し、これらの化合物に光学活性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの混合物および単離された異性体の双方を包含する。]で示されるピリミジノン誘導体およびその塩。

2.  $R_a$ が $C_1-C_4$ アルキル基、 $C_1-C_4$ ハロアルキル基または $C_1-C_4$ アルキルスルホニル基を表し、

$X$ が水素原子、 $C_1-C_4$ アルキル基またはアミノ基を表し、

$Y$ が酸素原子を表し、

$Z^1$ が窒素原子を表し、

$Z^2$ が $CR_b$ を表し、

$R_b$ がハロゲン原子を表し、

$R^1$ が水素原子またはフッ素原子を表し、

$R^2$ が水素原子を表す請求項1記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

3. Xがメチル基を表す請求項2記載のピリミジノン誘導体およびその塩。
4. R<sub>a</sub>がCHF<sub>2</sub>またはCF<sub>3</sub>を表す請求項2記載のピリミジノン誘導体およびその塩。
5. 請求項1記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する農薬。
6. 請求項1記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する除草剤。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Beck, James R.; Babbitt, George E.; Lynch, Michael P. Synthesis of ethyl 2-[ (1-aryl-1H-1,2,4-triazol-3-yl)oxyl]propionates and related derivatives, J. Heterocycl. Chem. (1988), 25(5), 1467-70, compound [9]	1
X	Breuker, Koos; Van der Plas, Henk C., Occurrence of an SN(ANRORC) mechanism in the Chichibabin amination of 4-phenylpyrimidine, J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80, compound 3	1
X	JP, 05-124924, A (Sansho Seiyaku Co., Ltd.), 21 May, 1993 (21.05.93), compounds 1-10 (Family: none)	1
P, X	WO, 01/10843, A (Mitsubishi Chemical Corporation), 15 February, 2001 (15.02.01) (Family: none)	1
P, X	JP, 2000-264888, A (Zaidan Hojin Sagami Chuo Kagaku Kenkyusho), 26 September, 2000 (26.09.00), working example (Family: none)	1

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"&amp;" document member of the same patent family

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

Date of the actual completion of the international search  
16 April, 2001 (16.04.01)Date of mailing of the international search report  
24 April, 2001 (24.04.01)Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Vroegop, S. M.; Chapman, D. L.; Decker, D. E.; Galinet, L. A.; Brideau, R. J.; Ready, K. A.; Dunn, C. J.; Buxser, S. E. Pharmacokinetic properties, induction of interferon, and efficacy if selected 5-halo-6-phenyl pyrimidinones, bropirimine analogues, in a model of severe experimental autoimmune encephalomyelitis, Int. J. Immunopharmacol. (1999), 21(10), 647-662; page 650, table	1
X	Abdel-Megid, Mohamed Synthesis of pyrimido[4,5-d]pyrimidinethione derivatives as biocidal agents, Heterocycl. Commun. (1998), 4(3), 235-243	1
X	WO, 98/25596, A (Pharmacia & Upjohn Co.), 18 June 1998 (18.06.98) & EP, 948331, A	1
X	Attaby, Fawzy A.; Eldin, Sanaa M.; Hanafi, Eman A. Z. Reactions of pyrimidinethione derivatives: synthesis of 2-hydrazinopyrimidin-4-one, pyrimido[1,2-a]-1,2,4-triazine, triazolo[1,2-a] pyrimidine, 2-(1-pyrazolo)pyrimidine and 2-arylhydrazonopyrimidine derivatives, Arch. Pharmacal Res. (1997), 20(06), 620-628	1
X	JP, 09-241161, A (Nippon Shinyaku Co., Ltd.), 16 September, 1997 (16.09.97), reference examples 1, 4 (Family: none)	1
X	Naghipur, G. A.; Saharia, G. S.; Sharma, D. P.; Sharma, H. R. Studies in heterocyclic compounds. Part XLV. 4-Methyl-6-aryl-5-(arylazo/N-substituted p-sulfamoylbenzenazo)pyrimidin-2-ols, J. Inst. Chem. (India) (1996), 68(2), 37-40	1
X	Krylova, L. F.; Shamovskaya, G. I.; Golovin, A. V.; Nogina, N. I., ortho-Palladated complexes containing isomeric 2- and 6-phenyl-4-pyrimidinones, Zh. Neorg. Khim. (1996), 41(3), 402-410; page 410, left column	1
X	WO, 94/06777, A (Zeneca Ltd.), 31 March, 1994 (31.03.94), working example IA & EP, 660827, A	1
X	Ram, Vishnu J., Chemotherapeutic agents: XVIII. Synthesis of .pi.-deficient pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicidal agents, Arch. Pharm. (Weinheim, Ger.) (1990), 323(11), 895-9, compounds 2, 3	1,2
X	Ram, Vishnu Ji, Chemotherapeutic agents. XII. Synthesis of pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicides and herbicides, J. Prakt. Chem. (1989), 331(6), 893-905	1-6
X	El-Sharabsy, Salwa A.; Abdel Gawad, Soad M.; Hussain, Sohair M., Reactions with substituted acrylonitriles: a novel synthesis of polysubstituted pyrimidines, J. Prakt. Chem. (1989), 331(2), 207-11, compounds 5a-h	1

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 63-30473, A (Zeria Shinyaku Kogyo K.K.), 09 February, 1988 (09.02.88), Claims; working example (Family: none)	1
X	Li, L. H.; DeKoning T. F.; Nicholas, J. A.; Kramer, G. D.; Wilson, D.; Wallace, T.L.; Collins, M. J., Jr. Effect of mouse hepatitis virus infection on combination therapy of P388 leukemia with cyclophosphamide and pyrimidinones, Lab. Anim. Sci. (1987), 37(1), 41-4, compounds ABPP, ABMFPP, AIMFPP	1
X	Sidky, Younan A.; Borden, Ernest C.; Wierenga, Wendell; Bryan, Geroge T., Inhibitory effects of interferon-inducing pyrimidinones on the growth of transplantable mouse bladder tumors., Cancer Res. (1986), 46(8), 3798-802, Fig. I	1
X	Skulnick, Harvey I.; Weed, Sheldon D.; Eidson, Emerson E.; Renis, Harold E.; Stringfellow, Dale A.; Wierenga, Wendell Pyrimidinones. 1. 2-Amino-5-halo-6-aryl-4(3H)-pyrimidinones. Interferon-inducing antiviral agents, J. Med. Chem. (1985), 28(12), 1864-9	1
X	JP, 56-154464, A (Efubii Shii Ltd.), 30 November, 1981 (30.11.81), example 56 & US, 4414221, A	1
X	JP, 55-127378, A (Upjohn Co.), 02 October, 1980 (02.10.80), Claims; working example & US, 4507302, A	1
X	Mass spectra of 2-thioxopyrimidine derivatives, Kishi, Hiroshi; Kambe, Satoshi, Shitsuryo Bunseki (1979), 27(2), 83-95; page 84, lower left side	1
X	Wynalda, M. A.; Fitzpatrick, F. A. High-performance liquid chromatographic determination of 5-halopyrimidinone interferon inducers, Anal. Chem. (1980), 52(12), 1931-4	1
X	US, 3829422, A (SANDOZ), 13 August, 1974 (13.08.74), examples 1, 4, 9 & US, 3663698, A	1, 2
X	JP, 04-49279, A (Nihon Bayer Agrochem. K.K.), 18 February, 1992 (18.02.92), Claims; working example 18 (Family: none)	1-6

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP01/02158

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2.  Claims Nos.: 1-6  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:  
  
See extra sheet.
  
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

The compounds of the invention do not have any novel common basic skeleton in their chemical structures.

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest     The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
                             No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP01/02158

Continuation of Box No.I-2 of continuation of first sheet(1)

A group of inventions of claims 1-4 and the inventions of claims 5 and 6 relate to compounds of the general formula (I), pesticides containing the same as the active ingredient, or the like. However, the smallest compounds represented by the general formula (I), which correspond to the case wherein  $R_a=R_b=X=H$  and  $Q=Ph$  ( $R^1=R^2=R^3=R^4=R^5=H$ ), are publicly known, because they are disclosed in J. Heterocycl. Chem. (1988), 25(5), 1467-70; J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80; and JP, 05-124924, A.

Accordingly, the compounds of the general formula (I) do not have any novel common basic skeleton in their structures, so that one invention cannot be grasped from each of the above claims carrying the compounds.

On the other hand, many specific examples of the above compounds are disclosed in the description; still, these examples correspond to only a small part of an extremely wide range of compounds included among those described above.

Therefore, the above claims and the description fail to comply with the prescribed requirements to such an extent that a meaningful search could not be carried out.

In this international search report, search was made in the sight of the disclosure of the description, with the non-fused phenyl groups defined as to Q being limited to those having ring-substituent halogen atoms.

## A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int cl<sup>7</sup> C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int cl<sup>7</sup> C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CA(STN), REGISTRY(STN), WPIDS(STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Beck, James R.; Babbitt, George E.; Lynch, Michael P. Synthesis of ethyl 2-[(1-aryl-1H-1,2,4-triazol-3-yl)oxy]propionates and related derivatives, J. Heterocycl. Chem. (1988), 25 (5), 1467-70, 化合物 [9]	1
X	Breuker, Koos; Van der Plas, Henk C., Occurrence of an SN(A NRORC) mechanism in the Chichibabin amination of 4-phenylpyrimidine, J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80, 化合物 3	1

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

## の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

16.04.01

国際調査報告の発送日

24.04.01

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員)

内藤 伸一

4C 8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) . 関連すると認められる文献		関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X	JP, 05-124924, A (三省製薬株式会社) 21. 5月. 1993 (21. 05. 93), 化合物1-10 (ファミリーなし)	1
P, X	WO, 01/10843, A (三菱化学株式会社) 15. 2月. 2 001 (15. 02. 01) (ファミリーなし)	1
P, X	JP, 2000-264888, A (財団法人相模中央化学研究 所) 26. 9月. 2000 (26. 09. 00), 実施例、(ファ ミリーなし)	
X	Vroegop, S. M.; Chapman, D. L.; Decker, D. E.; Galinet, L. A.; Brideau, R.J.; Ready, K. A.; Dunn, C. J.; Buxser, S. E. Pharmacokinetic properties, induction of interferon, and eff icacy of selected 5-halo-6-phenyl pyrimidinones, bropirimine analogues, in a model of severe experimental autoimmune en cephalomyelitis, Int. J. Immunopharmacol. (1999), 21(10), 647 -662, p650の表	1
X	Abdel-Megid, MohamedSynthesis of pyrimido[4,5-d]pyrimidineth ione derivatives as biocidal agents, Heterocycl. Commun. (1 998), 4(3), 235-243	1
X	WO, 98/25596, A (Pharmacia & Upjohn Co.) 18. 6 月. 1998 (18. 06. 98) & EP, 948331, A	1
X	Attaby, Fawzy A.; Eldin, Sanaa M.; Hanafi, Eman A. Z. Reactions of pyrimidinonethione derivatives: synthesis of 2 -hydrazinopyrimidin-4-one, pyrimido[1,2-a]-1,2,4-triazine, tr iazolo-[1,2-a]pyrimidine, 2-(1-pyrazolo)pyrimidine and 2-ary lhydrazonopyrimidine derivatives, Arch. Pharmacal Res. (199 7), 20(6), 620-628	1
X	JP, 09-241161, A (日本新薬株式会社) 16. 9月. 1997 (16. 09. 97), 参考例1, 4 (ファミリーなし)	1
X	Naghipur, G. A.; Saharia, G. S.; Sharma, D. P.; Sharma, H. R. Studies in heterocyclic compounds. Part XLV. 4-Methyl-6-a ryl-5-(arylazo/N-substituted p-sulfamoylbenzenazo)pyrimidin -2-ols, J. Inst. Chem. (India) (1996), 68(2), 37-40	1
X	Krylova, L. F.; Shamovskaya, G. I.; Golovin, A. V.; Nogina, N. I., ortho-Palladated complexes containing isomeric 2- an d 6-phenyl-4-pyrimidinones, Zh. Neorg. Khim. (1996), 41(3), 402-410、p410左欄	1

C (続き) 関連すると認められる文献		関連する請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X	WO, 94/06777, A (ZENECA Ltd.) 31. 3月. 1994 (31. 03. 94) 実施例 I A & EP, 660827, A	1
X	Ram, Vishnu J., Chemotherapeutic agents. XVIII. Synthesis of pi-deficient pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicidal agents, Arch. Pharm. (Weinheim, Ger.) (1990), 323 (11), 895-9, 化合物 2, 3	1, 2
X	Ram, Vishnu Ji, Chemotherapeutic agents. XII. Synthesis of pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicides and herbicides, J. Prakt. Chem. (1989), 331(6), 893-905	1-6
X	El-Sharabsy, Salwa A.; Abdel Gawad, Soad M.; Hussain, Sohair M., Reactions with substituted acrylonitriles: a novel synthesis of polysubstituted pyrimidines, J. Prakt. Chem. (1989), 331(2), 207-11, 化合物 5 a-h	1
X	JP, 63-30473, A (ゼリア新薬工業株式会社) 9. 2月. 1988 (09. 02. 88) 特許請求の範囲、実施例 (アミリーなし)	1
X	Li, L. H.; DeKoning, T. F.; Nicholas, J. A.; Kramer, G. D.; Wilson, D.; Wallace, T. L.; Collins, M. J., Jr. Effect of mouse hepatitis virus infection on combination therapy of P388 leukemia with cyclophosphamide and pyrimidinones, Lab. Anim. Sci. (1987), 37(1), 41-4, 化合物 ABPP, ABMFP, AIMFP	1
X	Sidky, Younan A.; Borden, Ernest C.; Wierenga, Wendell; Bryan, George T., Inhibitory effects of interferon-inducing pyrimidinones on the growth of transplantable mouse bladder tumors., Cancer Res. (1986), 46(8), 3798-802, Fig. I	1
X	Skulnick, Harvey I.; Weed, Sheldon D.; Eidson, Emerson E.; Renis, Harold E.; Stringfellow, Dale A.; Wierenga, Wendell P. pyrimidinones. 1. 2-Amino-5-halo-6-aryl-4(3H)-pyrimidinone s. Interferon-inducing antiviral agents, J. Med. Chem. (1985), 28(12), 1864-9	1
X	JP, 56-154464, A (エフ・ビー・シー) 30. 11月. 1981 (30. 11. 81) 例56 & US, 4414221, A	1
X	JP, 55-127378, A (アップジョン) 2. 10月. 1980 (02. 10. 80), 特許請求の範囲、実施例 & US, 4507302, A	1

C(続き)	関連すると認められる文献	関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X	Mass spectra of 2-thioxopyrimidine derivatives, Kishi, Hiroshi; Kambe, Satoshi, Shitsuryo Bunseki (1979), 27(2), 83-95, 84頁左下	1
X	Wynalda, M. A.; Fitzpatrick, F. A. High-performance liquid chromatographic determination of 5-halopyrimidinone interferon inducers, Anal. Chem. (1980), 52(12), 1931-4	1
X	U.S., 3829422, A (SANDOZ) 13. 8月. 1974 (13. 08. 74) 実施例1, 4, 9 & U.S., 3663698, A	1, 2
X	J P, 04-49279, A (日本バイエルアグロケム株式会社) 18. 2月. 1992 (18. 02. 92) 特許請求の範囲、実施例18 (ファミリーなし)	1-6

## 第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1.  請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
2.  請求の範囲 1-6 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

別紙参照

3.  請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

本願発明化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通しているものとはいえない。

1.  出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2.  追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3.  出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4.  出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

## 第I欄の2.について

請求の範囲1-4及び同5, 6に係る発明は、一般式(I)で表される化合物又はそれを有効成分とする農薬等の発明であるが、同化合物における最小の化合物である、R<sub>a</sub>=R<sub>b</sub>=X=HかつQ=Ph (R<sub>1</sub>=R<sub>2</sub>=R<sub>3</sub>=R<sub>4</sub>=R<sub>5</sub>=H)である化合物が、

J. Heterocycl. Chem. (1988), 25(5), 1467-70

J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80

JP, 05-124924, A

により公知であるから、同化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通して有しているものではない。してみれば、このような化合物を記載する上記請求の範囲各項からは、一の発明を明確に把握することができない。

一方、明細書には、上記化合物の具体例が多数開示されているが、それでも、上記化合物に包含される著しく広範な化合物のごく一部のものであるといわざるを得ない。

したがって、上記請求の範囲及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

なお、この国際調査報告では、明細書の記載内容に照らし、一般式(I)で表される化合物において、Qが、他の環と縮合していないフェニル環であるときは、該フェニル環上にハロゲンが置換している場合のものについて、調査を行った。